

Rec'd PCT/PTO 02 MAR 2003



PCT/EP 03/526524 047 #2

EP 03/10047

**SCHWEIZERISCHE EIDGENOSSENSCHAFT
CONFÉDÉRATION SUISSE
CONFEDERAZIONE SVIZZERA**

REC'D 06 OCT 2003

WIPO

PCT

Bescheinigung

Die beiliegenden Akten stimmen mit den ursprünglichen technischen Unterlagen des auf der nächsten Seite bezeichneten Patentgesuches für die Schweiz und Liechtenstein überein. Die Schweiz und das Fürstentum Liechtenstein bilden ein einheitliches Schutzgebiet. Der Schutz kann deshalb nur für beide Länder gemeinsam beantragt werden.

Attestation

Les documents ci-joints sont conformes aux pièces techniques originales de la demande de brevet pour la Suisse et le Liechtenstein spécifiée à la page suivante. La Suisse et la Principauté de Liechtenstein constituent un territoire unitaire de protection. La protection ne peut donc être revendiquée que pour l'ensemble des deux Etats.

**PRIORITY DOCUMENT
SUBMITTED OR TRANSMITTED IN
COMPLIANCE WITH
RULE 17.1(a) OR (b)**

Attestazione

I documenti allegati sono conformi agli atti tecnici originali della domanda di brevetto per la Svizzera e il Liechtenstein specificata nella pagina seguente. La Svizzera e il Principato di Liechtenstein formano un unico territorio di protezione. La protezione può dunque essere rivendicata solamente per l'insieme dei due Stati.

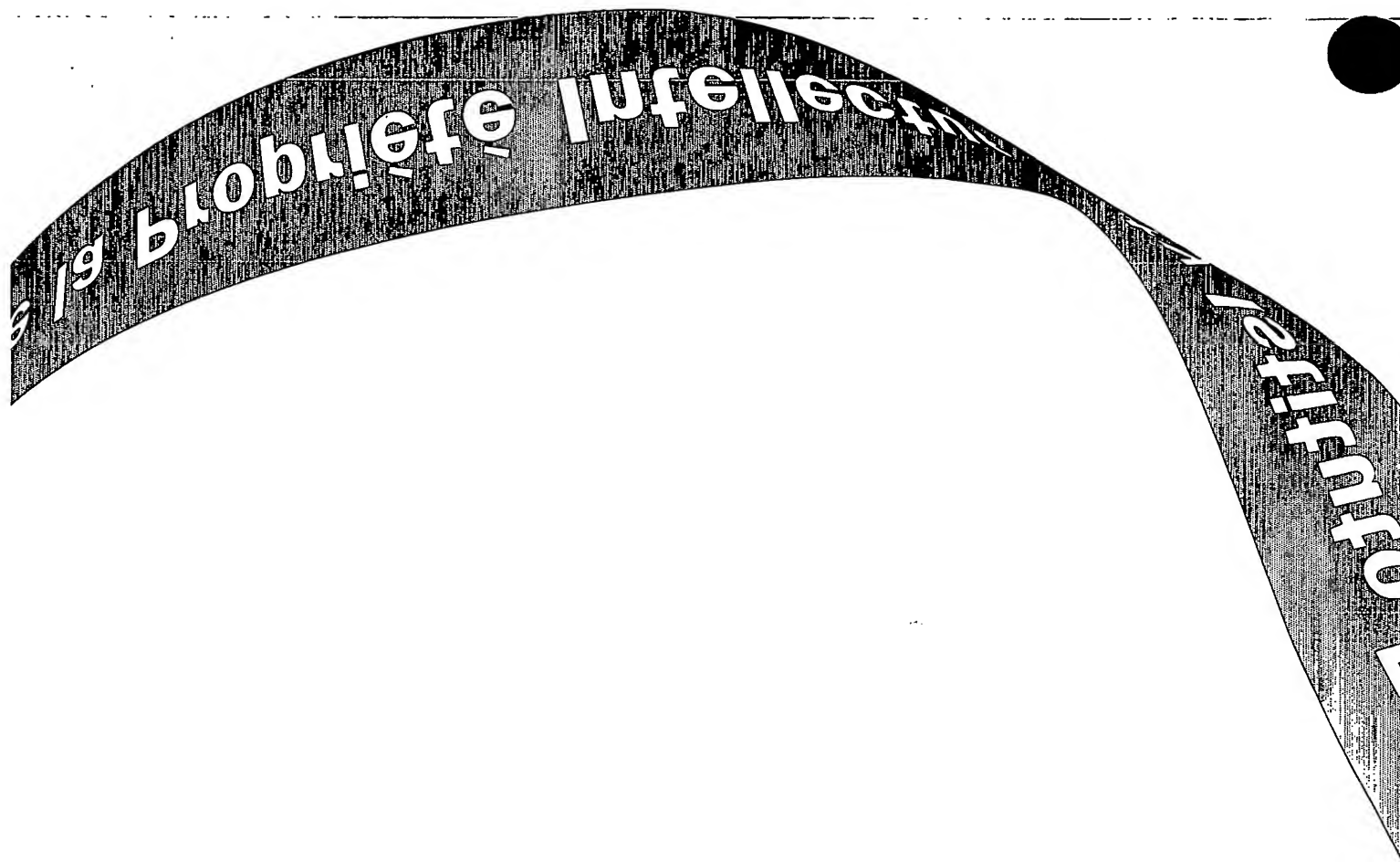
Bern, 16 JUNI 2003

Eidgenössisches Institut für Geistiges Eigentum
Institut Fédéral de la Propriété Intellectuelle
Istituto Federale della Proprietà Intellettuale

Patentverfahren
Administration des brevets
Amministrazione dei brevetti

H. Jenni
Heinz Jenni

BEST AVAILABLE COPY



900% MUL. 3 1

Patentgesuch Nr. 2002 1542/02

HINTERLEGUNGSBESCHEINIGUNG (Art. 46 Abs. 5 PatV)

Das Eidgenössische Institut für Geistiges Eigentum bescheinigt den Eingang des unten näher bezeichneten schweizerischen Patentgesuches.

Titel:
Organische Verbindungen.

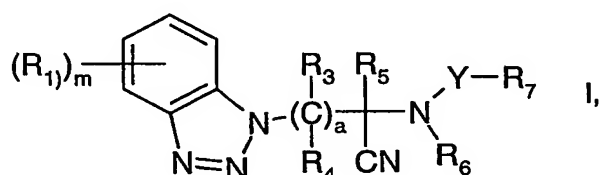
Patentbewerber:
NOVARTIS AG
Lichtstrasse 35
4056 Basel

Anmeldedatum: 11.09.2002

Voraussichtliche Klassen: A61K, C07D

Organische Verbindungen

Die vorliegende Erfindung betrifft neue Benztriazolyl-aminoacetonitril-Verbindungen der Formel



worin

R_1 Halogen, Cyano, Nitro, C_1 - C_6 -Alkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, Halo- C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -Alkylthio, Arylthio, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_3 - C_6 -Cycloalkyloxy, Halo- C_1 - C_6 -alkoxy, C_1 - C_6 -Alkylcarbonyl, Halo- C_1 - C_6 -alkylcarbonyl, C_1 - C_6 -Alkylsulfinyl, C_1 - C_6 -Alkylsulfonyl, C_1 - C_6 -Alkylamino, Di(C_1 - C_6 -alkyl)amino, unsubstituiertes oder substituiertes Aryl oder unsubstituiertes oder substituiertes Phenoxy, wobei die Substituenten jeweils voneinander unabhängig sein können und ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Halogen, Nitro, Cyano, C_1 - C_6 -Alkyl, Halo- C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, Halo- C_1 - C_6 -alkoxy, C_1 - C_6 -Alkylthio, Halo- C_1 - C_6 -alkylthio, C_1 - C_6 -Alkylsulfinyl, Halo- C_1 - C_6 -alkylsulfinyl, C_1 - C_6 -Alkylsulfonyl und Halo- C_1 - C_6 -alkylsulfonyl;

R_3 , R_4 und R_5 entweder unabhängig von einander Wasserstoff, Halogen, C_1 - C_6 -Alkyl, Halo- C_1 - C_6 -alkyl, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes C_3 - C_6 -Cycloalkyl, wobei die Substituenten voneinander unabhängig sein können und ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Halogen und C_1 - C_6 -Alkyl; unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Phenyl, wobei die Substituenten von einander unabhängig sein können und ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Halogen, Nitro, Cyano, C_1 - C_6 -Alkyl, Halo- C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, Halo- C_1 - C_6 -alkoxy, C_1 - C_6 -Alkylthio, Halo- C_1 - C_6 -alkylthio, C_1 - C_6 -Alkylsulfinyl, Halo- C_1 - C_6 -alkylsulfinyl, C_1 - C_6 -Alkylsulfonyl, Halo- C_1 - C_6 -alkylsulfonyl, C_1 - C_6 -Alkylamino oder Di(C_1 - C_6 -alkyl)amino; oder R_4 und R_5 gemeinsam C_2 - C_6 -Alkylen;

R_6 Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Alkylcarbonyl, C_1 - C_6 -Alkoxy- C_1 - C_6 -alkyl, Aminocarbonyl, C_1 - C_6 -Alkoxycarbonyl, Halo- C_1 - C_6 -alkylcarbonyl, Thio- C_1 - C_6 -alkylcarbonyl oder Benzyl;

R_7 Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Alkylamino, Di(C_1 - C_6 -alkyl)amino, Piperonyl, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Phenyl, wobei die

Substituenten voneinander unabhängig sein können und ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, Halo-C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₃-C₆-Cycloalkoxy, Halo-C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-Alkenyl, Halo-C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-Alkylthio, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₂-C₆-Alkenyloxy, Halo-C₂-C₆-alkenyloxy, C₁-C₆-Alkylthio, Halo-C₁-C₆-alkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfonyloxy, Halo-C₁-C₆-alkylsulfonyloxy, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, Halo-C₁-C₆-alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, Halo-C₁-C₆-alkylsulfonyl, C₂-C₆-Alkenylthio, Halo-C₂-C₆-alkenylthio, C₂-C₆-Alkenylsulfinyl, Halo-C₂-C₆-alkenylsulfinyl, C₂-C₆-Alkenylsulfonyl, Halo-C₂-C₆-alkenylsulfonyl, C₁-C₆-Alkylamino, Di(C₁-C₆-alkyl)amino, C₁-C₆-Alkylsulfonylamino, Halo-C₁-C₆-alkylsulfonylamino, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, Halo-C₁-C₆-alkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxy carbonyl, C₁-C₆-Alkylaminocarbonyl, Di(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Aryl-C₁-C₆-alkyl, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Arylamino, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Arylcarbonyl, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Arylcarbonyloxy, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Aryloxy, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Aryloxy-C₁-C₆-alkyl, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Hetaryloxy-C₁-C₆-alkyl, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Aryloxycarbonyl, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Arylsulfonyl, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Arylsulfonylamino, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Pyridyloxy und unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Phenylacetylenyl, wobei jeweils die Substituenten voneinander unabhängig sein können und ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, Halo-C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, Halo-C₁-C₆-alkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, Halo-C₁-C₆-alkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, Halo-C₁-C₆-alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl und Halo-C₁-C₆-alkylsulfonyl; unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Hetaryl, wobei die Substituenten voneinander unabhängig sein können und ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, Halo-C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, Halo-C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-Alkenyloxy, Halo-C₂-C₆-alkenyloxy, C₁-C₆-Alkylthio, Halo-C₁-C₆-alkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, Halo-C₁-C₆-alkylsulfinyl, C₂-C₆-Alkenylthio, Halo-C₂-C₆-alkenylthio, C₂-C₆-Alkenylsulfinyl, Halo-C₂-C₆-alkenylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, Halo-C₁-C₆-alkylsulfonyl, C₂-C₆-Alkenylsulfonyl, Halo-C₂-C₆-alkenylsulfonyl, C₁-C₆-Alkylamino und Di(C₁-C₆-alkyl)amino; oder unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Naphthyl oder Chinolyl, wobei die Substituenten voneinander unabhängig sein können und ausgewählt sind aus der

Gruppe, bestehend aus Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, Halo-C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, Halo-C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-Alkenyloxy, Halo-C₂-C₆-alkenyloxy, C₁-C₆-Alkylthio, Halo-C₁-C₆-alkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, Halo-C₁-C₆-alkylsulfinyl, C₂-C₆-Alkenylthio, Halo-C₂-C₆-alkenylthio, C₂-C₆-Alkenylsulfinyl, Halo-C₂-C₆-alkenylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, Halo-C₁-C₆-alkylsulfonyl, C₂-C₆-Alkenylsulfonyl, Halo-C₂-C₆-alkenylsulfonyl, C₁-C₆-Alkylamino und Di(C₁-C₆-alkyl)amino;

R₈ und R₉ unabhängig von einander Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkylthiocarbonyl, Thio-C₁-C₆-alkylcarbonyl, Aryl oder Hetaryl;

Y eine direkte Bindung, C(O), C(S) oder S(O)_n;

a 1, 2 oder 3;

m 0, 1, 2, 3 oder 4; und

n 1 oder 2 ist;

ihre Herstellung und Verwendung zur Bekämpfung von Endo- und Ektoparasiten, insbesondere Helminthen, in und auf warmblütigen Nutz- und Haustieren und Pflanzen, ferner Schädlingsbekämpfungsmittel, welche mindestens eine dieser Verbindungen enthalten.

Substituierte Aminoacetonitril-Verbindungen mit pestizider Wirkung sind beispielsweise in EP-0'953'565 A2 beschrieben. Die dort konkret offenbarten Wirkstoffe können jedoch die Anforderungen bezüglich Wirkungsstärke und Wirkungsspektrum nicht immer erfüllen. Es besteht somit ein Bedarf nach Wirkstoffen mit verbesserten pestiziden Eigenschaften. Es wurde nun gefunden, dass die Aminoacetonitril-Verbindungen der Formel I herausragende pestizide Eigenschaften, insbesondere gegen Endo- und Ektoparasiten in und auf Nutz- und Haustieren und Pflanzen, besitzen.

Aryl ist Phenyl oder Naphthyl.

Hetaryl ist Pyridyl, Pyrimidyl, s-Triazinyl, 1,2,4-Triazinyl, Thienyl, Furanyl, Pyrrol, Pyrazolyl, Imidazolyl, Thiazolyl, Triazolyl, Oxazolyl, Thiadiazolyl, Oxadiazolyl, Benzothienyl, Benzofuranyl, Benzothiazolyl, Indolyl oder Indazolyl, bevorzugt Pyridyl, Pyrimidyl, s-Triazinyl oder 1,2,4-Triazinyl, insbesondere Pyridyl oder Pyrimidyl.

Alkyl - als Gruppe per se sowie als Strukturelement von anderen Gruppen und Verbindungen, wie beispielsweise von Haloalkyl, Alkoxy und Alkylthio, - ist, jeweils unter gebührender Berücksichtigung der von Fall zu Fall umfassten Anzahl der in der entsprechenden Gruppe

oder Verbindung enthaltenen Kohlenstoffatome, entweder geradkettig, d. h. Methyl, Ethyl, Propyl, Butyl, Pentyl oder Hexyl, oder verzweigt, z. B. iso-Propyl, iso-Butyl, sek.-Butyl, tert.-Butyl, Isopentyl, Neopentyl oder Iso-Hexyl.

Alkenyl - als Gruppe per se sowie als Strukturelement von anderen Gruppen und Verbindungen - ist, jeweils unter gebührender Berücksichtigung der von Fall zu Fall umfassten Anzahl der in der entsprechenden Gruppe oder Verbindung enthaltenen Kohlenstoffatome und konjugierten oder isolierten Doppelbindungen, entweder geradkettig, z. B. Allyl, 2-Butenyl, 3-Pentenyl, 1-Hexenyl oder 1,3-Hexadienyl oder verzweigt, z. B. iso-Propenyl, Iso-Butenyl, Isoprenyl, tert-Pentenyl oder Iso-Hexenyl.

Alkinyl - als Gruppe per se sowie als Strukturelement von anderen Gruppen und Verbindungen - ist, jeweils unter gebührender Berücksichtigung der von Fall zu Fall umfassten Anzahl der in der entsprechenden Gruppe oder Verbindung enthaltenen Kohlenstoffatome und konjugierten oder isolierten Doppelbindungen, entweder geradkettig, z. B. Propargyl, 2-Butinyl, 3-Pentinyl, 1-Hexinyl, 1-Heptinyl oder 3-Hexen-1-inyl, oder verzweigt, z. B. 3-Methylbut-1-inyl, 4-Ethylpent-1-inyl oder 4-Methylhex-2-inyl.

Cycloalkyl - als Gruppe per se sowie als Strukturelement von anderen Gruppen und Verbindungen, wie z. B. von Halocycloalkyl, - ist, jeweils unter gebührender Berücksichtigung der von Fall zu Fall umfassten Anzahl der in der entsprechenden Gruppe oder Verbindung enthaltenen Kohlenstoffatome, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl.

Halogen - als Gruppe per se sowie als Strukturelement von anderen Gruppen und Verbindungen, wie von Haloalkyl, Haloalkoxy und Haloalkylthio - ist Fluor, Chlor, Brom oder Iod, insbesondere Fluor, Chlor oder Brom, vor allem Fluor oder Chlor.

Halogensubstituierte kohlenstoffhaltige Gruppen und Verbindungen, wie Haloalkyl, Haloalkoxy oder Haloalkylthio, können teilweise halogeniert oder perhalogeniert sein, wobei im Falle von Mehrfach-Halogenierung die Halogensubstituenten gleich oder verschieden sein können. Beispiele für Haloalkyl - als Gruppe per se sowie als Strukturelement von anderen Gruppen und Verbindungen, wie von Haloalkoxy, oder Haloalkylthio, sind das ein- bis dreifach durch Fluor, Chlor und/oder Brom substituierte Methyl, wie CHF_2 oder CF_3 ; das ein- bis fünffach durch Fluor, Chlor und/oder Brom substituierte Ethyl, wie CH_2CF_3 , CF_2CF_3 , CF_2CCl_3 , CF_2CHCl_2 , CF_2CHF_2 , CF_2CFCl_2 , CF_2CHBr_2 , CF_2CHClF , CF_2CHBrF oder CClFCHClF ; das ein- bis siebenfach durch Fluor, Chlor und/oder Brom substituierte Propyl oder iso-Propyl, wie $\text{CH}_2\text{CHBrCH}_2\text{Br}$, $\text{CF}_2\text{CHFCH}_2\text{F}$, $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ oder $\text{CH}(\text{CF}_3)_2$; das ein- bis

neunfach durch Fluor, Chlor und/oder Brom substituierte Butyl oder eines seiner Isomeren, wie $\text{CF}(\text{CF}_3)\text{CHF}\text{CF}_3$ oder $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_2\text{CF}_3$; das ein- bis elffach durch Fluor, Chlor und/oder Brom substituierte Pentyl oder eines seiner Isomeren, wie $\text{CF}(\text{CF}_3)(\text{CHF})_2\text{CF}_3$ oder $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$; und das ein- bis dreizehnfach durch Fluor, Chlor und/oder Brom substituierte Hexyl oder eines seiner Isomeren, wie $(\text{CH}_2)_4\text{CHBrCH}_2\text{Br}$, $\text{CF}_2(\text{CHF})_4\text{CF}_3$, $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_4\text{CF}_3$ oder $\text{C}(\text{CF}_3)_2(\text{CHF})_2\text{CF}_3$.

Alkoxygruppen haben vorzugsweise eine Kettenlänge von 1 bis 6 Kohlenstoffatomen. Alkoxy ist beispielsweise Methoxy, Ethoxy, Propoxy, i-Propoxy, n-Butoxy, iso-Butoxy, sek.-Butoxy und tert.-Butoxy sowie die Isomeren Pentyloxy und Hexyloxy; vorzugsweise Methoxy und Ethoxy. Haloalkoxygruppen haben vorzugsweise eine Kettenlänge von 1 bis 6 Kohlenstoffatomen. Haloalkoxy ist z.B. Fluormethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, 2,2,2-Trifluorethoxy, 1,1,2,2-Tetrafluorethoxy, 2-Fluorethoxy, 2-Chlorethoxy, 2,2-Difluorethoxy und 2,2,2-Trichlorethoxy; vorzugsweise Difluormethoxy, 2-Chlorethoxy und Trifluormethoxy.

Alkylthiogruppen haben vorzugsweise eine Kettenlänge von 1 bis 6 Kohlenstoffatomen. Alkylthio ist beispielsweise Methylthio, Ethylthio, Propylthio, iso-Propylthio, n-Butylthio, iso-Butylthio, sek.-Butylthio oder tert.-Butylthio, vorzugsweise Methylthio und Ethylthio.

Bevorzugte Ausführungsformen im Rahmen der Erfindung sind:

(1) Eine Verbindung der Formel I, worin R_1 Halogen, Cyano, Nitro, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -Alkyl, Halo- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alkyl, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -Alkoxy, Halo- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alkoxy, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -Alkylcarbonyl, Halo- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alkylcarbonyl, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -Alkylsulfonyl oder unsubstituiertes oder substituiertes Phenoxy, wobei die Substituenten voneinander unabhängig sein können und ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Halogen, Nitro, Cyano, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -Alkyl, Halo- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alkyl, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -Alkoxy und Halo- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alkoxy; besonders Halogen, Cyano, Nitro, $\text{C}_1\text{-C}_2$ -Alkyl, Halo- $\text{C}_1\text{-C}_2$ -alkyl, $\text{C}_1\text{-C}_2$ -Alkoxy, Halo- $\text{C}_1\text{-C}_2$ -alkoxy oder unsubstituiertes oder substituiertes Phenoxy, wobei die Substituenten voneinander unabhängig sein können und ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Halogen, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -Alkyl, Halo- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alkyl, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -Alkoxy und Halo- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alkoxy; ganz besonders Halogen, Cyano, Nitro, $\text{C}_1\text{-C}_2$ -Alkyl, Halo- $\text{C}_1\text{-C}_2$ -alkyl, $\text{C}_1\text{-C}_2$ -Alkoxy oder Halo- $\text{C}_1\text{-C}_2$ -alkoxy;

(2) Eine Verbindung der Formel I, worin R_3 , R_4 und R_5 entweder unabhängig von einander Wasserstoff, Halogen, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -Alkyl, Halo- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alkyl, $\text{C}_3\text{-C}_6$ -Cycloalkyl, unsubstituiertes oder

ein- oder mehrfach substituiertes Phenyl, wobei die Substituenten von einander unabhängig sein können und ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, Halo-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, Halo-C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio und Halo-C₁-C₄-alkylthio; oder R₄ und R₅ gemeinsam C₂-C₆-Alkylen;

besonders unabhängig von einander Wasserstoff, Halogen, C₁-C₂-Alkyl, Halo-C₁-C₂-alkyl oder C₃-C₆-Cycloalkyl;

ganz besonders unabhängig von einander Wasserstoff, Methyl oder Halo-methyl;

(3) Eine Verbindung der Formel I, worin R₆ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl oder Benzyl;

besonders Wasserstoff, C₁-C₂-Alkyl, C₁-C₂-Alkylcarbonyl oder Benzyl;

ganz besonders Wasserstoff oder C₁-C₂-Alkyl;

(4) Eine Verbindung der Formel I, worin R₇ unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Phenyl, wobei die Substituenten voneinander unabhängig sein können und ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, Halo-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, Halo-C₁-C₄-alkoxy, C₂-C₄-Alkenyl, Halo-C₂-C₄-alkenyl, C₂-C₄-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₂-C₄-Alkenyloxy, Halo-C₂-C₄-alkenyloxy, C₁-C₄-Alkylthio, Halo-C₁-C₄-alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfonyloxy, Halo-C₁-C₄-alkylsulfonyloxy, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, Halo-C₁-C₄-alkylsulfonyl, C₂-C₄-Alkenylsulfonyl, Halo-C₂-C₄-alkenylsulfonyl, C₁-C₄-Alkylamino, Di(C₁-C₄-alkyl)amino, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, Halo-C₁-C₄-alkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Aryl-C₁-C₄-alkyl, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Aryloxy, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Aryloxy-C₁-C₄-alkyl, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Hetaryloxy-C₁-C₄-alkyl, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Aryloxycarbonyl, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Arylsulfonyl und unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Pyridyloxy, wobei jeweils die Substituenten voneinander unabhängig sein können und ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, Halo-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, Halo-C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, Halo-C₁-C₄-alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfonyl und Halo-C₁-C₄-alkylsulfonyl;

unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Hetaryl, wobei die Substituenten voneinander unabhängig sein können und ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus

Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, Halo-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, Halo-C₁-C₄-alkoxy, C₂-C₄-Alkenyloxy, Halo-C₂-C₄-alkenyloxy, C₁-C₄-Alkylthio, Halo-C₁-C₄-alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfonyl und Halo-C₁-C₄-alkylsulfonyl; oder

unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Naphthyl oder Chinolyl, wobei die Substituenten voneinander unabhängig sein können und ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, Halo-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, Halo-C₁-C₄-alkoxy, C₂-C₄-Alkenyloxy, Halo-C₂-C₄-alkenyloxy, C₁-C₄-Alkylthio, Halo-C₁-C₄-alkylthio, C₂-C₄-Alkenylthio, Halo-C₂-C₄-alkenylthio, C₁-C₄-Alkylsulfonyl und Halo-C₁-C₄-alkylsulfonyl;

besonders unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Aryl, wobei die Substituenten voneinander unabhängig sein können und ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₂-Alkyl, Halo-C₁-C₂-alkyl, C₁-C₂-Alkoxy, Halo-C₁-C₂-alkoxy, C₃-C₅-Cycloalkyl, C₁-C₂-Alkylthio, Halo-C₁-C₂-alkylthio, C₁-C₂-Alkylsulfonyl, Halo-C₁-C₂-alkylsulfonyl, C₁-C₂-Alkylcarbonyl, Halo-C₁-C₂-alkylcarbonyl, C₁-C₂-Alkoxycarbonyl, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Aryl-C₁-C₂-alkyl, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Aryloxy, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Aryloxy-C₁-C₂-alkyl und unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Pyridyloxy, wobei jeweils die Substituenten voneinander unabhängig sein können und ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₂-Alkyl, Halo-C₁-C₂-alkyl, C₁-C₂-Alkoxy, Halo-C₁-C₂-alkoxy, C₁-C₂-Alkylthio, Halo-C₁-C₂-alkylthio, C₁-C₂-Alkylsulfonyl und Halo-C₁-C₂-alkylsulfonyl; oder

unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Hetaryl, wobei die Substituenten voneinander unabhängig sein können und ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₂-Alkyl, Halo-C₁-C₂-alkyl, C₁-C₂-Alkoxy, Halo-C₁-C₂-alkoxy, C₂-C₄-Alkenyloxy, Halo-C₂-C₄-alkenyloxy, C₁-C₂-Alkylthio, Halo-C₁-C₂-alkylthio, C₁-C₂-Alkylsulfonyl und Halo-C₁-C₂-alkylsulfonyl;

ganz besonders unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Aryl, wobei die Substituenten voneinander unabhängig sein können und ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Halogen, Cyano, C₁-C₂-Alkyl, Halo-C₁-C₂-alkyl, C₁-C₂-Alkoxy, Halo-C₁-C₂-alkoxy, C₃-C₅-Cycloalkyl, C₁-C₂-Alkylcarbonyl, Halo-C₁-C₂-alkylcarbonyl, C₁-C₂-Alkoxycarbonyl, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Aryl-C₁-C₂-alkyl und unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Aryloxy-C₁-C₂-alkyl, wobei jeweils die Substituenten voneinander unabhängig sein können und ausgewählt sind aus der

Gruppe, bestehend aus Halogen, Cyano, C₁-C₂-Alkyl, Halo-C₁-C₂-alkyl, C₁-C₂-Alkoxy und Halo-C₁-C₂-alkoxy;

(5) Eine Verbindung der Formel I, worin R₈ und R₉ unabhängig von einander Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl oder Aryl;

besonders unabhängig von einander Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;

ganz besonders unabhängig von einander Wasserstoff oder C₁-C₂-Alkyl;

(6) Eine Verbindung der Formel I, worin Y C(O) oder S(O)_n;

besonders C(O);

(7) Eine Verbindung der Formel I, worin a 1 oder 2;

besonders 1;

(8) Eine Verbindung der Formel I, worin m 1, 2 oder 3;

besonders 1 oder 2;

(9) Eine Verbindung der Formel I, worin n 2;

(10) Eine Verbindung der Formel I, worin

R₁ Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, Halo-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, Halo-C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, Halo-C₁-C₄-alkylcarbonyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl oder unsubstituiertes oder substituiertes Phenoxy, wobei die Substituenten voneinander unabhängig sein können und ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, Halo-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy und Halo-C₁-C₄-alkoxy;

R₃, R₄ und R₅ entweder unabhängig von einander Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, Halo-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Phenyl, wobei die Substituenten von einander unabhängig sein können und ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, Halo-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, Halo-C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio und Halo-C₁-C₄-alkylthio; oder R₄ und R₅ gemeinsam C₂-C₆-Alkylen;

R₆ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl oder Benzyl;

R₇ unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Phenyl, wobei die Substituenten voneinander unabhängig sein können und ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, Halo-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, Halo-C₁-C₄-alkoxy, C₂-

C₄-Alkenyl, Halo-C₂-C₄-alkenyl, C₂-C₄-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₂-C₄-Alkenyloxy, Halo-C₂-C₄-alkenyloxy, C₁-C₄-Alkylthio, Halo-C₁-C₄-alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfonyloxy, Halo-C₁-C₄-alkylsulfonyloxy, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, Halo-C₁-C₄-alkylsulfonyl, C₂-C₄-Alkenylsulfonyl, Halo-C₂-C₄-alkenylsulfonyl, C₁-C₄-Alkylamino, Di(C₁-C₄-alkyl)amino, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, Halo-C₁-C₄-alkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Aryl-C₁-C₄-alkyl, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Aryloxy, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Aryloxy-C₁-C₄-alkyl, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Hetaryloxy-C₁-C₄-alkyl, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Aryloxycarbonyl, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Arylsulfonyl und unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Pyridyloxy, wobei jeweils die Substituenten voneinander unabhängig sein können und ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, Halo-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, Halo-C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, Halo-C₁-C₄-alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfonyl und Halo-C₁-C₄-alkylsulfonyl; unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Hetaryl, wobei die Substituenten voneinander unabhängig sein können und ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, Halo-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, Halo-C₁-C₄-alkoxy, C₂-C₄-Alkenyloxy, Halo-C₂-C₄-alkenyloxy, C₁-C₄-Alkylthio, Halo-C₁-C₄-alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfonyl und Halo-C₁-C₄-alkylsulfonyl; oder unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Naphthyl oder Chinolyl, wobei die Substituenten voneinander unabhängig sein können und ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, Halo-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, Halo-C₁-C₄-alkoxy, C₂-C₄-Alkenyloxy, Halo-C₂-C₄-alkenyloxy, C₁-C₄-Alkylthio, Halo-C₁-C₄-alkylthio, C₂-C₄-Alkenylthio, Halo-C₂-C₄-alkenylthio, C₁-C₄-Alkylsulfonyl und Halo-C₁-C₄-alkylsulfonyl; R₈ und R₉ unabhängig von einander Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl oder Aryl;

Y C(O) oder S(O)_n;

a 1 oder 2;

m 1, 2 oder 3; und

n 2;

(11) Eine Verbindung der Formel I, worin

R₁ Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₂-Alkyl, Halo-C₁-C₂-alkyl, C₁-C₂-Alkoxy, Halo-C₁-C₂-alkoxy oder unsubstituiertes oder substituiertes Phenoxy, wobei die Substituenten voneinander unabhängig sein können und ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Halogen, C₁-C₄-Alkyl, Halo-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy und Halo-C₁-C₄-alkoxy;

R₃, R₄ und R₅ unabhängig von einander Wasserstoff, Halogen, C₁-C₂-Alkyl, Halo-C₁-C₂-alkyl oder C₃-C₆-Cycloalkyl;

R₆ Wasserstoff, C₁-C₂-Alkyl, C₁-C₂-Alkylcarbonyl oder Benzyl;

R₇ unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Phenyl, wobei die Substituenten voneinander unabhängig sein können und ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₂-Alkyl, Halo-C₁-C₂-alkyl, C₁-C₂-Alkoxy, Halo-C₁-C₂-alkoxy, C₃-C₅-Cycloalkyl, C₁-C₂-Alkylthio, Halo-C₁-C₂-alkylthio, C₁-C₂-Alkylsulfonyl, Halo-C₁-C₂-alkylsulfonyl, C₁-C₂-Alkylcarbonyl, Halo-C₁-C₂-alkylcarbonyl, C₁-C₂-Alkoxycarbonyl, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Aryl-C₁-C₂-alkyl, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Aryloxy, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Aryloxy-C₁-C₂-alkyl und unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Pyridyloxy, wobei jeweils die Substituenten voneinander unabhängig sein können und ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₂-Alkyl, Halo-C₁-C₂-alkyl, C₁-C₂-Alkoxy, Halo-C₁-C₂-alkoxy, C₁-C₂-Alkylthio, Halo-C₁-C₂-alkylthio, C₁-C₂-Alkylsulfonyl und Halo-C₁-C₂-alkylsulfonyl; oder unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Hetaryl, wobei die Substituenten voneinander unabhängig sein können und ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₂-Alkyl, Halo-C₁-C₂-alkyl, C₁-C₂-Alkoxy, Halo-C₁-C₂-alkoxy, C₂-C₄-Alkenyloxy, Halo-C₂-C₄-alkenyloxy, C₁-C₂-Alkylthio, Halo-C₁-C₂-alkylthio, C₁-C₂-Alkylsulfonyl und Halo-C₁-C₂-alkylsulfonyl;

R₈ und R₉ unabhängig von einander Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;

Y C(O);

a 1; und

m 1 oder 2;

(12) Eine Verbindung der Formel I, worin

R₁ Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₂-Alkyl, Halo-C₁-C₂-alkyl, C₁-C₂-Alkoxy oder Halo-C₁-C₂-alkoxy;

R_3 , R_4 und R_5 unabhängig von einander Wasserstoff, Methyl oder Halo-methyl;

R_6 Wasserstoff oder C_1 - C_2 -Alkyl;

R_7 unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Phenyl, wobei die Substituenten voneinander unabhängig sein können und ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Halogen, Cyano, C_1 - C_2 -Alkyl, Halo- C_1 - C_2 -alkyl, C_1 - C_2 -Alkoxy, Halo- C_1 - C_2 -alkoxy, C_3 - C_5 -Cycloalkyl, C_1 - C_2 -Alkylcarbonyl, Halo- C_1 - C_2 -alkylcarbonyl, C_1 - C_2 -Alkoxycarbonyl, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Aryl- C_1 - C_2 -alkyl und unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Aryloxy- C_1 - C_2 -alkyl, wobei jeweils die Substituenten voneinander unabhängig sein können und ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Halogen, Cyano, C_1 - C_2 -Alkyl, Halo- C_1 - C_2 -alkyl, C_1 - C_2 -Alkoxy und Halo- C_1 - C_2 -alkoxy;

R_8 und R_9 unabhängig von einander Wasserstoff oder C_1 - C_2 -Alkyl;

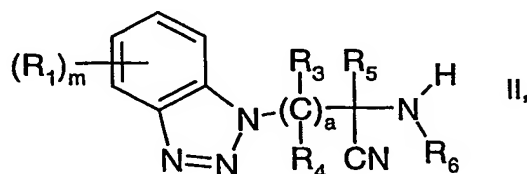
Y C(O);

a 1; und

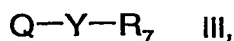
m 1 oder 2 ist.

Besonders bevorzugt sind im Rahmen der Erfindung die in Tabelle 1 aufgeführten und ganz besonders bevorzugt die in den Synthesebeispielen genannten Verbindungen der Formel I.

Als weiterer Gegenstand der Erfindung ist das Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I, jeweils in freier Form oder in Salzform, z. B. dadurch gekennzeichnet, dass man eine Verbindung der Formel



die bekannt ist oder in Analogie zu entsprechenden bekannten Verbindungen hergestellt werden kann und worin R_1 , R_3 , R_4 , R_5 , R_6 , a und m die für die Formel I angegebenen Bedeutungen haben, mit einer Verbindung der Formel



die bekannt ist oder in Analogie zu entsprechenden bekannten Verbindungen hergestellt werden kann und worin Y und R_7 die für die Formel I angegebenen Bedeutungen hat und Q eine Abgangsgruppe ist, gegebenenfalls in Gegenwart eines basischen Katalysators,

umsetzt, und jeweils, wenn erwünscht, eine verfahrensgemäss oder auf andere Weise erhältliche Verbindung der Formel I, jeweils in freier Form oder in Salzform, in eine andere Verbindung der Formel I überführt, ein verfahrensgemäss erhältliches Gemisch von Isomeren auftrennt und das gewünschte Isomere isoliert und/oder eine verfahrensgemäss erhältliche freie Verbindung der Formel I in ein Salz oder ein verfahrensgemäss erhältliches Salz einer Verbindung der Formel I in die freie Verbindung der Formel I oder in ein anderes Salz überführt.

Für vor- und nachstehend aufgeführte Ausgangsmaterialien gilt im Hinblick auf deren Salze das vorstehend für Salze von Verbindungen I Gesagte in analoger Weise.

Die Reaktionspartner können als solche, d. h. ohne Zusatz eines Lösungs- oder Verdünnungsmittels, z. B. in der Schmelze, miteinander umgesetzt werden. Zumeist ist jedoch der Zusatz eines inerten Lösungs- oder Verdünnungsmittels oder eines Gemisches derselben vorteilhaft. Als Beispiele für solche Lösungs- oder Verdünnungsmittel seien genannt: aromatische, aliphatische und alicyclische Kohlenwasserstoffe und Halogenkohlenwasserstoffe, wie Benzol, Toluol, Xylol, Mesitylen, Tetralin, Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Brombenzol, Petrolether, Hexan, Cyclohexan, Dichlormethan, Trichlormethan, Tetrachlormethan, Dichlorethan, Trichlorethen oder Tetrachlorethen; Ether, wie Diethylether, Dipropylether, Diisopropylether, Dibutylether, tert.-Butylmethylether, Ethylenglykolmonomethylether, Ethylenglykolmonoethylether, Ethylenglykoldimethylether, Dimethoxydiethylether, Tetrahydrofuran oder Dioxan; Ketone, wie Aceton, Methylethylketon oder Methylisobutylketon; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Diethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Nitrile, wie Acetonitril oder Propionitril; und Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid.

Bevorzugte Abgangsgruppen sind Halogene, insbesondere Chlor.

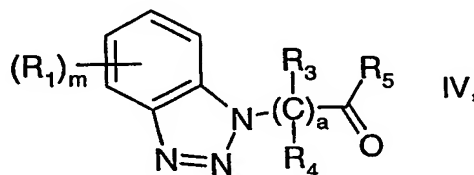
Geeignete Basen zur Erleichterung der Umsetzung sind z. B. Alkalimetall- oder Erdalkalimetallhydroxide, -hydride, -amide, -alkanolate, -acetate, -carbonate, -dialkylamide oder -alkylsilylamine, Alkylamine, Alkylendiamine, gegebenenfalls N-alkylierte, gegebenenfalls ungesättigte, Cycloalkylamine, basische Heterocyclen, Ammoniumhydroxide sowie carbocyclische Amine. Beispielhaft seien Natriumhydroxid, -hydrid, -amid, -methanolat, -acetat, -carbonat, Kalium-t.-butanolat, -hydroxid, -carbonat, -hydrid, Lithiumdiisopropylamid, Kalium-bis(trimethylsilyl)-amid, Calciumhydrid, Triethylamin, Diisopropylethylamin, Triethylendiamin, Cyclohexylamin, N-Cyclohexyl-N,N-dimethylamin, N,N-Diethylanilin,

Pyridin, 4-(N,N-Dimethylamino)pyridin, Chinuclidin, N-Methylmorpholin, Benzyltrimethylammoniumhydroxid sowie 1,5-Diazabicyclo[5.4.0]undec-5-en (DBU) genannt. Bevorzugt sind Diisopropylethylamin und 4-(N,N-Dimethylamino)pyridin.

Die Umsetzung erfolgt vorteilhaft in einem Temperaturbereich von etwa 0°C bis etwa +100°C, bevorzugt von etwa 10°C bis etwa +40°C.

In einem bevorzugten Verfahren wird eine Verbindung der Formel II bei Raumtemperatur in einem Halogenkohlenwasserstoff, bevorzugt Dichlormethan, mit einer Verbindung der Formel III in Gegenwart einer Base, bevorzugt einem Gemisch von Diisopropylethylamin und 4-(N,N-Dimethylamino)pyridin, umgesetzt.

Als weiterer Gegenstand der Erfindung ist das Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel II, jeweils in freier Form oder in Salzform, z. B. dadurch gekennzeichnet, dass man eine Verbindung der Formel



die bekannt ist oder in Analogie zu entsprechenden bekannten Verbindungen hergestellt werden kann und worin R_1 , R_3 , R_4 , R_5 , a und m die für die Formel I angegebenen Bedeutungen haben, mit einem anorganischen oder organischen Cyanid und einer Verbindung der Formel R_6-NH_2 , die bekannt ist oder in Analogie zu entsprechenden bekannten Verbindungen hergestellt werden kann und worin R_6 die für die Formel I angegebenen Bedeutungen hat, umsetzt, und jeweils, wenn erwünscht, eine verfahrensgemäss oder auf andere Weise erhältliche Verbindung der Formel II, jeweils in freier Form oder in Salzform, in eine andere Verbindung der Formel II überführt, ein verfahrensgemäss erhältliches Gemisch von Isomeren auftrennt und das gewünschte Isomere isoliert und/oder eine verfahrensgemäss erhältliche freie Verbindung der Formel II in ein Salz oder ein verfahrensgemäss erhältliches Salz einer Verbindung der Formel II in die freie Verbindung der Formel II oder in ein anderes Salz überführt.

Geeignete Cyanide sind Natriumcyanid, Kaliumcyanid, Trimethylsilylcyanid und Acetoncyanhydrin.

Die allgemeine Methode der Umsetzung von Carbonylverbindungen, wie z. B. der Formel IV, mit Cyaniden und Aminen, wie z. B. der Formel R_6-NH_2 , ist als Strecker-Reaktion

bekannt, beispielsweise in Organic Synthesis Coll. Vol. 3, 88 (1973).

Salze von Verbindungen I können in an sich bekannter Weise hergestellt werden. So erhält man beispielsweise Säureadditionssalze von Verbindungen I durch Behandeln mit einer geeigneten Säure oder einem geeigneten Ionenaustauscherreagens und Salze mit Basen durch Behandeln mit einer geeigneten Base oder einem geeigneten Ionenaustauscherreagens.

Salze von Verbindungen I können in üblicher Weise in die freien Verbindungen I überführt werden, Säureadditionssalze z. B. durch Behandeln mit einem geeigneten basischen Mittel oder einem geeigneten Ionenaustauscherreagens und Salze mit Basen z. B. durch Behandeln mit einer geeigneten Säure oder einem geeigneten Ionenaustauscherreagens.

Salze von Verbindungen I können in an sich bekannter Weise in andere Salze von Verbindungen I umgewandelt werden, Säureadditionssalze beispielsweise in andere Säureadditionssalze, z. B. durch Behandeln eines Salzes einer anorganischen Säure, wie eines Hydrochlorids, mit einem geeigneten Metallsalz, wie einem Natrium-, Barium- oder Silbersalz, einer Säure, z. B. mit Silberacetat, in einem geeigneten Lösungsmittel, in welchem ein sich bildendes anorganisches Salz, z. B. Silberchlorid, unlöslich ist und damit aus dem Reaktionsgemisch ausscheidet.

Je nach Verfahrensweise bzw. Reaktionsbedingungen können die Verbindungen I mit salzbildenden Eigenschaften in freier Form oder in Form von Salzen erhalten werden.

Salze von Verbindungen I können in an sich bekannter Weise hergestellt werden. So erhält man beispielsweise Säureadditionssalze von Verbindungen I durch Behandeln mit einer geeigneten Säure oder einem geeigneten Ionenaustauscherreagens und Salze mit Basen durch Behandeln mit einer geeigneten Base oder einem geeigneten Ionenaustauscherreagens.

Salze von Verbindungen I können in üblicher Weise in die freien Verbindungen I überführt werden, Säureadditionssalze z. B. durch Behandeln mit einem geeigneten basischen Mittel oder einem geeigneten Ionenaustauscherreagens und Salze mit Basen z. B. durch Behandeln mit einer geeigneten Säure oder einem geeigneten Ionenaustauscherreagens.

Salze von Verbindungen I können in an sich bekannter Weise in andere Salze von Verbindungen I umgewandelt werden, Säureadditionssalze beispielsweise in andere Säureadditionssalze, z. B. durch Behandeln eines Salzes einer anorganischen Säure, wie eines

Hydrochlorids, mit einem geeigneten Metallsalz, wie einem Natrium-, Barium- oder Silbersalz, einer Säure, z. B. mit Silberacetat, in einem geeigneten Lösungsmittel, in welchem ein sich bildendes anorganisches Salz, z. B. Silberchlorid, unlöslich ist und damit aus dem Reaktionsgemisch ausscheidet.

Die Verbindungen I können auch in Form ihrer Hydrate erhalten werden und/oder andere, beispielsweise gegebenenfalls zur Kristallisation von in fester Form vorliegenden Verbindungen verwendete, Lösungsmittel einschliessen.

Die Verbindungen I und II können gegebenenfalls als optische und/oder geometrische Isomere bzw. deren Gemische vorliegen. Die Erfindung betrifft sowohl die reinen Isomeren als auch alle möglichen Isomerengemische und ist vor- und nachstehend jeweils entsprechend zu verstehen, auch wenn stereochemische Einzelheiten nicht in jedem Fall speziell erwähnt werden.

Verfahrensgemäss oder anderweitig erhältliche Diastereomerengemische von Verbindungen I können auf Grund der physikalisch-chemischen Unterschiede der Bestandteile in bekannter Weise in die reinen Diastereomeren aufgetrennt werden, beispielsweise durch fraktionierte Kristallisation, Destillation und/oder Chromatographie.

Entsprechend erhältliche Enantiomerengemische, lassen sich nach bekannten Methoden in die reinen Isomeren aufspalten, beispielsweise durch Umkristallisation aus einem optisch aktiven Lösungsmittel, durch Chromatographie an chiralen Adsorbentien, z. B.

Hochdruckflüssigkeitschromatographie (HPLC) an Acetylcellulose, mit Hilfe von geeigneten Mikroorganismen, durch Spaltung mit spezifischen, immobilisierten Enzymen, über die Bildung von Einschlussverbindungen, z. B. unter Verwendung chiraler Kronenether, wobei nur ein Enantiomeres komplexiert wird.

Ausser durch Auftrennung entsprechender Isomerengemische können reine Diastereomere bzw. Enantiomere erfindungsgemäss auch durch allgemein bekannte Methoden der diastereoselektiven bzw. enantioselektiven Synthese erhalten werden, z. B. indem man das erfindungsgemässe Verfahren mit Edukten mit entsprechend geeigneter Stereochemie ausführt.

Vorteilhaft isoliert bzw. synthetisiert man jeweils das biologisch wirksamere Isomere, z. B. Enantiomere, oder Isomerengemisch, z. B. Enantiomerengemisch, sofern die einzelnen Komponenten unterschiedliche biologische Wirksamkeit besitzen.

Beim Verfahren der vorliegenden Erfindung werden vorzugsweise solche Ausgangsstoffe und Zwischenprodukte verwendet, welche zu den eingangs als besonders wertvoll geschilderten Verbindungen I führen.

Die Erfindung betrifft insbesondere das im Beispiel beschriebene Herstellungsverfahren.

Erfindungsgemäss für die Herstellung der Verbindungen I verwendete Ausgangsstoffe und Zwischenprodukte, die neu sind, ihre Verwendung und Verfahren zu ihrer Herstellung bilden ebenfalls einen Gegenstand der Erfindung.

Die erfindungsgemässen Verbindungen I zeichnen sich durch ein besonders breites Wirkungsspektrum aus und sind bei günstiger Warmblüter-, Fisch- und Pflanzenverträglichkeit wertvolle Wirkstoffe auf dem Gebiet der Schädlingsbekämpfung, darunter insbesondere zur Bekämpfung von tierparasitären Endo- und Ektoparasiten.

Unter Ektoparasiten versteht man im Zusammenhang mit der vorliegenden Erfindung, insbesondere Insekten, Milben und Zecken. Eingeschlossen sind Insekten der Ordnungen: *Lepidoptera*, *Coleoptera*, *Homoptera*, *Heteroptera*, *Diptera*, *Thysanoptera*, *Orthoptera*, *Anoplura*, *Siphonaptera*, *Mallophaga*, *Thysanura*, *Isoptera*, *Psocoptera* und *Hymenoptera*. Besonders erwähnt seien jedoch Ektoparasiten, welche Menschen oder Tiere plagen und Krankheitserreger übertragen, wie z. B. Fliegen, wie *Musca domestica*, *Musca vetustissima*, *Musca autumnalis*, *Fannia canicularis*, *Sarcophaga carnaria*, *Lucilia cuprina*, *Hypoderma bovis*, *Hypoderma lineatum*, *Chrysomya chloropyga*, *Dermatobia hominis*, *Cochliomyia hominivorax*, *Gasterophilus intestinalis*, *Oestrus ovis*, *Stomoxys calcitrans*, *Haematobia irritans* und Mücken (*Nematocera*), wie *Culicidae*, *Simuliidae*, *Psychodidae*, aber auch blutsaugendes Parasiten, wie beispielsweise Flöhe, wie *Ctenocephalides felis* und *Ctenocephalides canis* (Katzen- und Hundeflöhe), *Xenopsylla cheopis*, *Pulex irritans*, *Dermatophilus penetrans*, Läuse, wie *Damalina ovis*, *Pediculus humanis*, Stechfliegen und Bremsen (*Tabanidae*), *Haematopota* spp. wie *Haematopota pluvialis*, *Tabanidea* spp. wie *Tabanus nigrovittatus*, *Chrysopsinae* spp. wie *Chrysops caecutiens*, Tsetsefliegen, wie Glossiniaarten, bissende Insekten, allen voran Schaben, wie *Blatella germanica*, *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, Milben wie *Dermanyssus gallinae*, *Sarcoptes scabiei*, *Psoroptes ovis* und *Psorergates* spp. und nicht zuletzt Zecken. Letztere gehören zur Ordnung Acarina. Bekannte Vertreter von Zecken sind, z.B. *Boophilus*, *Amblyomma*, *Anocentor*, *Dermacentor*, *Haemaphysalis*, *Hyalomma*, *Ixodes*, *Rhipicentor*, *Margaropus*, *Rhipicephalus*, *Argas*, *Otobius* und *Ornithodoros* und ähnliche, die vorzugsweise

warmblütige Tiere, einschliesslich Farmtiere, wie Kühe, Schweine, Schafe und Ziegen, Geflügel wie Hühner, Truthühner und Gänse, Felltiere wie Nerze, Füchse, Chinchillas, Kaninchen und ähnliche, sowie Haustiere wie Katzen und Hunde, aber auch Menschen befallen.

Die Verbindungen I sind auch einsetzbar gegen Hygiene-Schädlinge, insbesondere der Ordnungen Diptera mit den Familien Sarcophagidae, Anophilidae und Culicidae; der Ordnungen Orthoptera, Dictyoptera (z. B. die Familie Blattidae) und Hymenoptera (z. B. die Familie Formicidae).

Die Verbindungen I besitzen auch nachhaltige Wirksamkeit bei pflanzenparasitären Milben und Insekten. Bei Spinnmilben der Ordnung Acarina sind sie wirksam gegen Eier, Nymphen und Adulte von Tetranychidae (Tetranychus spp. und Panonychus spp.).

Hohe Aktivität besitzen sie bei den saugenden Insekten der Ordnung Homoptera, insbesondere gegen Schädlinge der Familien Aphididae, Delphacidae, Cicadellidae, Psyllidae, Loccidae, Diaspididae und Eriophyidae (z. B. Rostmilbe auf Zitrusfrüchten); der Ordnungen Hemiptera, Heteroptera und Thysanoptera, sowie bei den pflanzenfressenden Insekten der Ordnungen Lepidoptera, Coleoptera, Diptera und Orthoptera.

Sie sind ebenfalls als Bodeninsektizid gegen Schädlinge im Erdboden geeignet.

Die Verbindungen der Formel I sind daher gegen alle Entwicklungsstadien saugender und fressender Insekten an Kulturen wie Getreide, Baumwolle, Reis, Mais, Soja, Kartoffeln, Gemüse, Früchten, Tabak, Hopfen, Citrus, Avocados und anderen wirksam.

Die Verbindungen der Formel I sind auch wirksam gegen Pflanzen-Nematoden der Arten Meloidogyne, Heterodera, Pratylenchus, Ditylenchus, Radopholus, Rizoglyphus und andere.

Insbesondere sind die Verbindungen gegen Helminthen wirksam, unter denen die endoparasitären Nematoden und Trematoden die Ursache schwerer Erkrankungen an Säugetieren und Geflügel sein können, z. B. an Schafen, Schweinen, Ziegen, Rindern, Pferden, Eseln, Hunden, Katzen, Meerschweinchen und Ziervögeln. Typische Nematoden dieser Indikation sind: Haemonchus, Trichostrongylus, Ostertagia, Nematodirus, Cooperia, Ascaris, Bunostomum, Oesophagostomum, Chabertia, Trichuris, Strongylus, Trichonema, Dictyocaulus, Capillaria, Heterakis, Toxocara, Ascaridia, Oxyuris, Ancylostoma, Uncinaria, Toxascaris und Parascaris. Unter den Trematoden ist speziell die Familie der Fasciolidae,

im besonderen *Fasciola hepatica*, zu nennen. Der besondere Vorteil der Verbindungen der Formel I ist ihre Wirksamkeit gegen solche Parasiten, die gegen Wirkstoffe auf Benzimidazol-Basis resistent sind.

Gewisse Spezies der Arten *Nematodirus*, *Cooperia* und *Oesophagostomum* greifen den Intestinaltrakt des Wirtstiers an, während andere der Arten *Haemonchus* und *Ostertagia* im Magen und solche der Art *Dictyocaulus* im Lungengewebe parasitieren. Parasiten der Familien Filariidae und Setariidae finden sich im internen Zellgewebe und den Organen, z. B. dem Herzen, den Blutgefässen, den Lymphgefässen und dem subkutanen Gewebe. Hier ist vor allem der Herzwurm des Hundes, *Dirofilaria immitis*, zu nennen. Die Verbindungen der Formel I sind gegen diese Parasiten hoch wirksam.

Weiter sind die Verbindungen der Formel I zur Bekämpfung von humanpathogenen Parasiten geeignet, unter denen als typische, im Verdauungstrakt vorkommende Vertreter solche der Arten *Ancylostoma*, *Necator*, *Ascaris*, *Strongyloides*, *Trichinella*, *Capillaria*, *Trichuris* und *Enterobius* zu nennen sind. Wirksam sind die Verbindungen der vorliegenden Erfindung auch gegen Parasiten der Arten *Wuchereria*, *Brugia*, *Onchocerca* und *Loa* aus der Familie der Filariidae, die im Blut, im Gewebe und verschiedenen Organen vorkommen, ferner gegen *Dracunculus* und Parasiten der Arten *Strongyloides* und *Trichinella*, die speziell den Gastrointestinalkanal infizieren.

Schliesslich weisen die Verbindungen der Formel I auch fungizide und bakterizide Wirkung auf.

Die gute pestizide Wirkung der erfindungsgemässen Verbindungen der Formel I entspricht einer Abtötungsrate (Mortalität) von mindestens 50-60 % der erwähnten Schädlinge. Insbesondere zeichnen sich die Verbindungen der Formel I durch eine aussergewöhnlich lange Wirkungsdauer aus.

Die Verbindungen der Formel I werden in unveränderter Form oder vorzugsweise zusammen mit den in der Formulierungstechnik üblichen Hilfsmitteln eingesetzt und können daher beispielsweise zu emulgierbaren Konzentraten, direkt verdünnbaren Lösungen, verdünnten Emulsionen, löslichen Pulvern, Granulaten, auch Verkapselungen in polymeren Stoffen in bekannter Weise verarbeitet werden. Die Anwendungsverfahren werden ebenso wie die Mittel den angestrebten Zielen und den gegebenen Verhältnissen entsprechend gewählt.

Die Formulierung, das heisst die den Wirkstoff der Formel I, beziehungsweise Kombinationen dieser Wirkstoffe mit anderen Wirkstoffen, und gegebenenfalls einen festen oder

flüssigen Zusatzstoff enthaltenden Mittel, Zubereitungen oder Zusammensetzungen, werden in bekannter Weise hergestellt, zum Beispiel durch inniges Vermischen und/oder Vermahlen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, wie beispielsweise mit Lösungsmitteln, festen Trägerstoffen, und gegebenenfalls oberflächenaktiven Verbindungen (Tensiden).

Als Lösungsmittel können in Frage kommen: Alkohole wie Ethanol, Propanol oder Butanol, und Glykole sowie deren Ether und Ester, wie Propylenglykol, Dipropylenglykoether, Ethylenglykol, Ethylenglykolmonomethyl- oder -ethylether, Ketone, wie Cyclohexanon, Isophoron oder Diacetanolalkohol, starke polare Lösungsmittel, wie N-Methyl-2-pyrrolidon, Dimethylsulfoxid oder Dimethylformamid oder Wasser, Pflanzenöle, wie Raps-, Rizinus-, Kokosnuss- oder Sojaöl; gegebenenfalls auch Silikonöle.

Bevorzugte Applikationsformen für die Anwendung bei Warmblütern zur Bekämpfung von Helminthen schliessen Lösungen, Emulsionen, Suspensionen (Drenches), Futtermittelzusätze, Pulver, Tabletten inklusive Brausetabletten, Boli, Kapseln, Mikroenkapsulierungen und Pour-on-Formulierungen ein, wobei auf die physiologische Verträglichkeit der Formulierungshilfsstoffe zu achten ist.

Als Bindemittel für Tabletten und Boli kommen chemisch abgewandelte, in Wasser oder Alkohol lösliche, polymere Naturstoffe in Frage, wie Stärke-, Cellulose- oder Protein-Derivate (z.B. Methylcellulose, Carboxymethylcellulose, Ethylhydroxyethylcellulose, Proteine wie Zein, Gelatine und dergleichen) sowie synthetische Polymere wie z.B. Polyvinylalkohol, Polyvinylpyrrolidon etc.. Ferner sind in Tabletten Füllstoffe (z.B. Stärke, mikrokristalline Cellulose, Zucker, Milchzucker etc.), Gleitmittel und Sprengmittel enthalten.

Liegen die anthelmintischen Mittel in Form von Futterkonzentraten vor, so dienen als Trägerstoffe z.B. Leistungsfutter, Futtergetreide oder Proteinkonzentrate. Solche Futterkonzentrate oder -mittel können ausser den Wirkstoffen noch Zusatzstoffe, Vitamine, Antibiotika, Chemotherapeutika, oder andere Pestizide, vornehmlich Bakterio- und Fungistatika, Coccidiostatika, oder auch Hormonpräparate, Stoffe mit anaboler Wirkung oder das Wachstum begünstigende, die Fleischqualität von Schlachttieren beeinflussende oder in anderer Weise für den Organismus nützliche Stoffe enthalten. Werden die Mittel oder die darin enthaltenen Wirkstoffe der Formel I direkt dem Futter oder den Viehtränken zugesetzt, so enthält das Fertigfutter oder die Fertigtränke die Wirkstoffe vorzugsweise in einer Konzentration von etwa 0,0005 bis 0,02 Gewichtsprozent (5-200 ppm).

Die erfindungsgemässen Verbindungen der Formel I kann man allein oder in Kombination mit anderen Bioziden einsetzen. Man kann sie z.B. zur Erhöhung der Wirkung mit Pestiziden dergleichen Wirkungsrichtung oder zur Verbreiterung des Wirkungsspektrums mit Substanzen anderer Wirkungsrichtung kombinieren. Es kann auch Sinn machen, abweisende Substanzen, sogenannte Repellents zuzusetzen. Sofern man das Wirkungsspektrum auf Endoparasiten, wie z.B. Würmer, ausdehnen möchte, kombiniert man die Verbindungen der Formel I zweckmässigerweise mit Substanzen, die endoparasitizide Eigenschaften aufweisen. Man kann sie selbstverständlich auch in Kombination mit antibakteriellen Mitteln verwenden. Da die Verbindungen der Formel I Adultizide darstellen, d.h. da sie vor allem gegen die ausgewachsenen Stadien der Zielparasiten wirken, kann der Zusatz von Pestiziden, die eher die juvenilen Parasitenstadien angreifen sehr vorteilhaft sein. Auf diese Weise erfasst man nämlich den grössten Teil jener Parasiten, die grossen wirtschaftlichen Schaden anrichten. Darüber hinaus trägt man auch noch wesentlich zur Vermeidung von Resistenzbildung bei. Manche Kombinationen können auch zu synergistischen Effekten führen, d.h. dass man die Gesamtaufwandmenge an Wirksubstanz reduzieren kann, was aus ökologischer Sicht wünschenswert ist. Bevorzugte Gruppen von Kombinationspartnern und besonders bevorzugte Kombinationspartner werden nachfolgend genannt, wobei Kombinationen zusätzlich zu einer Verbindung der Formel I einen oder mehrere dieser Partner enthalten können.

Als geeignete Mischungspartner kommen Biozide wie z.B. die nachfolgend genannten und dem Fachmann hinlänglich bekannten Insektizide und Akarizide mit unterschiedlichem Wirkungsmechanismus, wie z.B. Chitinsynthesehemmer, Wachstumsregulatoren; Wirkstoffe, die wie Juvenilhormone wirken; Wirkstoffe, die als Adultizide agieren; Breitbandinsektizide, Breitbandakarizide und Nematizide; aber auch die hinlänglich bekannten Anthelmintika und Insekten und/oder Acarina abwehrende Substanzen, besagte Repellents bzw. Detacher.

Nichtlimitierende Beispiele für geeignete Insektizide und Akarizide sind:

1. Abamectin
2. AC 303 630
3. Acephat
4. Acrinathrin
5. Alanycarb
6. Aldicarb

7. α -Cypermethrin
8. Alphamethrin
9. Amitraz
10. Avermectin B ₁
11. AZ 60541
12. Azinphos A

13. Azinphos M
14. Azinphos-methyl
15. Azocyclotin
16. <i>Bacillus subtil.</i> toxin
17. Bendiocarb
18. Benfuracarb

19. Bensultap
20. β -Cyfluthrin
21. Bifenthrin
22. BPMC
23. Brofenprox
24. Bromophos A
25. Bufencarb
26. Buprofezin
27. Butocarboxin
28. Butylpyridaben
29. Cadusafos
30. Carbaryl
31. Carbofuran
32. Carbophenthion
33. Cartap
34. Chloethocarb
35. Chlorethoxyfos
36. Chlorfenapyr
37. Chlorfluazuron
38. Chlormephos
39. Chlorpyrifos
40. Cis-Resmethrin
41. Clocythrin
42. Clofentezin
43. Cyanophos
44. Cycloprothrin
45. Cyfluthrin
46. Cyhexatin
47. D 2341
48. Deltamethrin
49. Demeton M
50. Demeton S

51. Demeton-S-methyl
52. Dibutylaminothio
53. Dichlofenthion
54. Dicliphos
55. Diethion
56. Diflubenzuron
57. Dimethoat
58. Dimethylvinphos
59. Dioxathion
60. DPX-MP062
61. Edifenphos
62. Enamectin
63. Endosulfan
64. Esfenvalerat
65. Ethiofencarb
66. Ethion
67. Ethofenprox
68. Ethoprophos
69. Etrimphos
70. Fenamiphos
71. Fenazaquin
72. Fenbutatinoxid
73. Fenitrothion
74. Fenobucarb
75. Fenothiocarb
76. Fenoxycarb
77. Fenpropathrin
78. Fenpyrad
79. Fenpyroximate
80. Fenthion
81. Fenvalerate
82. Fipronil

83. Fluazinam
84. Fluazuron
85. Flucycloxuron
86. Flucythrinat
87. Flufenoxuron
88. Flufenprox
89. Fonophos
90. Formothion
91. Fosthiazat
92. Fubfenprox
93. HCH
94. Heptenophos
95. Hexaflumuron
96. Hexythiazox
97. Hydroprene
98. Imidacloprid
99. Insekten-aktive Pilze
100. Insekten-aktive Nematoden
101. Insekten-aktive Viren
102. Iprobenfos
103. Isofenphos
104. Isoprocarb
105. Isoxathion
106. Ivermectin
107. λ -Cyhalothrin
108. Lufenuron
109. Malathion
110. Mecarbam
111. Mesulfenphos
112. Metaldehyd

113. Methamidophos
114. Methiocarb
115. Methomyl
116. Methoprene
117. Metolcarb
118. Mevinphos
119. Milbemectin
120. Moxidectin
121. Naled
122. NC 184
123. NI-25, Acetamiprid
124. Nitenpyram
125. Omethoat
126. Oxamyl
127. Oxydemethon M
128. Oxydeprofos
129. Parathion
130. Parathion-methyl
131. Permethrin
132. Phenthoat
133. Phorat
134. Phosalone
135. Phosmet
136. Phoxim
137. Pirimicarb
138. Pirimiphos A

139. Pirimiphos M
140. Promecarb
141. Propaphos
142. Propoxur
143. Prothiofos
144. Prothoat
145. Pyrachlophos
146. Pyradaphenthion
147. Pyresmethrin
148. Pyrethrum
149. Pyridaben
150. Pyrimidifen
151. Pyriproxyfen
152. RH 5992
153. RH-2485
154. Salithion
155. Sebufos
156. Silafluofen
157. Spinosad
158. Sulfotep
159. Sulprofos
160. Tebufenozide
161. Tebufenpyrad
162. Tebupirimphos
163. Teflubenzuron
164. Tefluthrin

165. Temephos
166. Terbam
167. Terbufos
168. Tetrachlorvinphos
169. Thiafenox
170. Thiodicarb
171. Thiofanox
172. Thionazin
173. Thuringiensin
174. Tralomethrin
175. Triarthen
176. Triazamate
177. Triazophos
178. Triazuron
179. Trichlorfon
180. Triflumuron
181. Trimethacarb
182. Vamidothion
183. XMC (3,5,-Xy- lylmethylcarbamate)
184. Xylylcarb
185. YI 5301/5302
186. ζ-Cypermethrin
187. Zetamethrin

Nichtlimitierende Beispiele für geeignete Anthelminthika werden nachfolgend genannt, wobei einige Vertreter neben der anthelminthischen auch noch eine insektizide und akarizide Aktivität aufweisen und z.T. schon in der oberen Liste enthalten sind:

(A1) Praziquantel = 2-Cyclohexylcarbonyl-4-oxo-1,2,3,6,7,11b-hexahydro-4H-pyrazino[2,1- α]isoquinolin

(A2) Closantel = 3,5-Diiodo-N-[5-chlor-2-methyl-4-(a-cyano-4-chlorbenzyl)phenyl]salicylamid

(A3) Triclabendazole = 5-Chlor-6-(2,3-dichlorphenoxy)-2-methylthio-1H-benzimidazol

(A4) Levamisol = L-(-)-2,3,5,6-Tetrahydro-6-phenylimidazo[2,1b]thiazol

(A5) Mebendazole = (5-Benzoyl-1H-benzimidazol-2-yl)carbaminsäuremethylester

(A6) Omphalotin = ein makrozyklisches Fermentationsprodukt des Fungus *Omphalotus olearius* beschrieben in WO 97/20857

(A7) Abamectin = Avermectin B1

(A8) Ivermectin = 22,23-Dihydroavermectin B1

(A9) Moxidectin = 5-O-Demethyl-28-deoxy-25-(1,3-dimethyl-1-butenyl)-6,28- epoxy-23-(methoxyimino)-milbemycin B

(A10) Doramectin = 25-Cyclohexyl-5-O-demethyl-25-de(1-methylpropyl)-avermectin A1a

(A11) Milbemectin = Gemisch von Milbemycin A3 and Milbemycin A4

(A12) Milbemycinoxim = 5-Oxim von Milbemectin

Nichtlimitierende Beispiele für geeignete abwehrende Substanzen (Repellents bzw. Detacher) sind:

(R1) DEET (N, N-Diethyl-m-toluamide)

(R2) KBR 3023 N-Butyl-2-oxycarbonyl-(2-hydroxy)-piperidin

(R3) Cymiazole = N,-2,3-Dihydro-3-methyl-1,3-thiazol-2-ylidene-2,4-xylidene

Die genannten Mischungspartner sind der Fachwelt bestens bekannt. Die meisten werden in den verschiedenen Ausgaben des Pesticide Manual, The British Crop Protection Council, London, andere in den verschiedenen Ausgaben von The Merck Index, Merck & Co., Inc., Rahway, New Jersey, USA oder in der Patentliteratur beschrieben. Daher beschränkt sich die nachfolgende Auflistung auf einige beispielhafte Fundstellen.

(I) 2-Methyl-2-(methylthio)propionaldehyd-O-Methylcarbamoyloxim (Aldicarb), aus The Pesticide Manual, 11th Ed. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 26;

(II) S-(3,4-Dihydro-4-oxobenzo[d]-[1,2,3]-triazin-3-ylmethyl)O,O-dimethyl-phosphorodithioat (Azinphos-methyl), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 67;

(III) Ethyl-N-[2,3-dihydro-2,2-dimethylbenzofuran-7-yloxycarbonyl-(methyl)aminothio]-N-isopropyl-β-alaninate (Benfuracarb), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 96;

- (IV) 2-Methylbiphenyl-3-ylmethyl-(Z)-(1*RS*)-*cis*-3-(2-chlor-3,3,3-trifluorprop-1-enyl)-2,2-dimethylcyclopropanecarboxylat (Bifenthrin), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 118;
- (V) 2-*tert*-Butylimino-3-isopropyl-5-phenyl-1,3,5-thiadiazian-4-on (Buprofezin), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 157;
- (VI) 2,3-Dihydro-2,2-dimethylbenzofuran-7-yl-methylcarbammat (Carbofuran), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 186;
- (VII) 2,3-Dihydro-2,2-dimethylbenzofuran-7-yl-(dibutylaminothio)methylcarbammat (Carbosulfan), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 188;
- (VIII) *S,S'*-(2-Dimethylaminotrimethylen)-bis(thiocarbamat) (Cartap), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 193;
- (IX) 1-[3,5-Dichlor-4-(3-chlor-5-trifluormethyl-2-pyridyloxy)phenyl]-3-(2,6-difluorbenzoyl)-harnstoff (Chlorfluazuron), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 213;
- (X) *O,O*-Diethyl-*O*-3,5,6-trichlor-2-pyridyl-phosphorothioat (Chlorpyrifos), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 235;
- (XI) (*RS*)- α -Cyano-4-fluor-3-phenoxybenzyl-(1*RS*,3*RS*;1*RS*,3*RS*)-3-(2,2-dichlorvinyl)-2,2-dimethylcyclopropanecarboxylat (Cyfluthrin), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 293;
- (XII) Gemisch von (*S*)- α -Cyano-3-phenoxybenzyl-(Z)-(1*R*,3*R*)-3-(2-chlor-3,3,3-trifluorpropenyl)-2,2-dimethylcyclopropanecarboxylat und (*R*)- α -Cyano-3-phenoxybenzyl-(Z)-(1*R*,3*R*)-3-(2-chlor-3,3,3-trifluorpropenyl)-2,2-dimethylcyclopropanecarboxylat (Lambda-Cyhalothrin), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 300;
- (XIII) Racemat bestehend aus (*S*)- α -Cyano-3-phenoxybenzyl-(1*R*,3*R*)-3-(2,2-dichlorvinyl)-2,2-dimethylcyclopropanecarboxylat und (*R*)- α -Cyano-3-phenoxybenzyl-(1*S*,3*S*)-3-(2,2-dichlorvinyl)-2,2-dimethylcyclopropanecarboxylat (Alpha-cypermethrin), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 308;
- (XIV) eine Mischung der Stereoisomere von (*S*)- α -Cyano-3-phenoxybenzyl (1*RS*,3*RS*;-1*RS*,3*RS*)-3-(2,2-dichlorvinyl)-2,2-dimethylcyclopropanecarboxylat (zeta-Cypermethrin),

aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 314;

(XV) (*S*)- α -Cyano-3-phenoxybenzyl-(1*R*,3*R*)-3-(2,2-dibromvinyl)-2,2-dimethylcyclopropan-carboxylat (Deltamethrin), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 344;

(XVI) (4-Chlorphenyl)-3-(2,6-difluorbenzoyl)harnstoff (Diflubenzuron), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 395;

(XVII) (1,4,5,6,7,7-Hexachlor-8,9,10-trinorborn-5-en-2,3-ylenbismethylen)-sulfit (Endosulfan), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 459;

(XVIII) α -Ethylthio-*o*-tolyl-methylcarbamat (Ethiofencarb), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 479;

(XIX) *O,O*-Dimethyl-*O*-4-nitro-*m*-tolyl-phosphorothioat (Fenitrothion), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 514;

(XX) 2-*sec*-Butylphenyl-methylcarbamat (Fenobucarb), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 516;

(XXI) (*RS*)- α -Cyano-3-phenoxybenzyl-(*RS*)-2-(4-chlorphenyl)-3-methylbutyrat (Fenvalerate), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 539;

(XXII) *S*-[Formyl(methyl)carbamoylmethyl]-*O,O*-dimethyl-phosphorodithioat (Formothion), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 625;

(XXIII) 4-Methylthio-3,5-xylyl-methylcarbamat (Methiocarb), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 813;

(XXIV) 7-Chlorbicyclo[3.2.0]hepta-2,6-dien-6-yl-dimethylphosphat (Heptenophos), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 670;

(XXV) 1-(6-Chlor-3-pyridylmethyl)-*N*-nitroimidazolidin-2-ylidenamin (Imidacloprid), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 706;

(XXVI) 2-Isopropylphenyl-methylcarbamat (Isoprocarb), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 729;

- (XXVII) *O,S*-Dimethyl-phosphoramidothioat (Methamidophos), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 808;
- (XXVIII) *S*-Methyl-*N*-(methylcarbamoyloxy)thioacetimidat (Methomyl), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 815;
- (XXIX) Methyl-3-(dimethoxyphosphinoyloxy)but-2-enoat (Mevinphos), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 844;
- (XXX) *O,O*-Diethyl-*O*-4-nitrophenyl-phosphorothioat (Parathion), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 926;
- (XXXI) *O,O*-Dimethyl-*O*-4-nitrophenyl-phosphorothioat (Parathion-methyl), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 928;
- (XXXII) *S*-6-Chlor-2,3-dihydro-2-oxo-1,3-benzoxazol-3-ylmethyl-*O,O*-diethyl-phosphorodithioat (Phosalone), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 963;
- (XXXIII) 2-Dimethylamino-5,6-dimethylpyrimidin-4-yl-dimethylcarbammat (Pirimicarb), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 985;
- (XXXIV) 2-Isopropoxyphenyl-methylcarbammat (Propoxur), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 1036;
- (XXXV) 1-(3,5-Dichlor-2,4-difluorphenyl)-3-(2,6-difluorbenzoyl)harnstoff (Teflubenzuron), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 1158;
- (XXXVI) *S*-tert-Butylthiomethyl-*O,O*-dimethyl-phosphorodithioat (Terbufos), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 1165;
- (XXXVII) Ethyl-(3-*tert*.-butyl-1-dimethylcarbamoyl-1*H*-1,2,4-triazol-5-yl-thio)-acetat, (Triazamate), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 1224;
- (XXXVIII) Abamectin, aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 3;
- (XXXIX) 2-sec-Butylphenyl-methylcarbammat (Fenobucarb), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 516;



- (XL) *N*-*tert*-Butyl-*N*-(4-ethylbenzoyl)-3,5-dimethylbenzohydrazid (Tebufenozide), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 1147;
- (XLI) (±)-5-Amino-1-(2,6-dichlor- α,α,α -trifluor-p-tolyl)-4-trifluormethyl-sulfinylpyrazol-3-carbonitril (Fipronil), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 545;
- (XLII) (*RS*)- α -Cyano-4-fluor-3-phenoxybenzyl(1*RS*,3*RS*;1*RS*,3*RS*)-3-(2,2-dichlorvinyl)-2,2-dimethylcyclopropancarboxylat (beta-Cyfluthrin), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 295;
- (XLIII) (4-Ethoxyphenyl)-[3-(4-fluor-3-phenoxyphenyl)propyl](dimethyl)silan (Silafluofen), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 1105;
- (XLIV) *tert*-Butyl (*E*)- α -(1,3-dimethyl-5-phenoxy-pyrazol-4-yl-methylenamino-oxy)-p-toluat (Fenpyroximate), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 530;
- (XLV) 2-*tert*-Butyl-5-(4-*tert*-butylbenzylthio)-4-chlorpyridazin-3(2*H*)-on (Pyridaben), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 1161;
- (XLVI) 4-[[4-(1,1-dimethylphenyl)phenyl]ethoxy]-quinazolin (Fenazaquin), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 507;
- (XLVII) 4-Phenoxyphenyl-(*RS*)-2-(pyridyloxy)propyl-ether (Pyriproxyfen), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 1073;
- (XLVIII) 5-Chloro-*N*-{2-[4-(2-ethoxyethyl)-2,3-dimethylphenoxy]ethyl}-6-ethylpyrimidin-4-amin (Pyrimidifen), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 1070;
- (XLIX) (*E*)-*N*-(6-Chlor-3-pyridylmethyl)-*N*-ethyl-*N*-methyl-2-nitrovinylidendiamin (Nitenpyram), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 880;
- (L) (*E*)-*N*¹-[(6-Chlor-3-pyridyl)methyl]-*N*²-cyano-*N*¹-methylacetamidin (NI-25, Acetamiprid), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 9;
- (LI) Avermectin B₁, aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 3;

- (LII) ein insektenaktives Extrakt aus einer Pflanze, besonders (2*R*,6*aS*,12*aS*)-1,2,6,6*a*,12,12*a*-hexhydro-2-isopropenyl-8,9-dimethoxy-chromeno[3,4-*b*]furo[2,3-*h*]chromen-6-on (Rotenone), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 1097; und ein Extrakt aus *Azadirachta indica*, insbesondere Azadirachtin, aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 59; und
- (LIII) ein Präparat, welches insektenaktive Nematoden enthält, bevorzugt *Heterorhabditis bacteriophora* und *Heterorhabditis megidis*, aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 671; *Steinernema feltiae*, aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 1115, und *Steinernema scapterisci*, aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 1116;
- (LIV) ein Präparat, erhältlich aus *Bacillus subtilis*, aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 72; oder aus einem *Bacillus thuringiensis* Stamm mit Ausnahme von Verbindungen isoliert aus GC91 oder aus NCTC11821; The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 73;
- (LV) ein Präparat, welches insektenaktive Pilze enthält, bevorzugt *Verticillium lecanii*, aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 1266; *Beauveria brogniartii*, aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 85; und *Beauveria bassiana*, aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 83;
- (LVI) ein Präparat, welche insektenaktive Viren enthält, bevorzugt *Neodiprion Sertifer* NPV, aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 1342; *Mamestra brassicae* NPV, aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 759; und *Cydia pomonella* *granulosis* Virus, aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 291;
- (CLXXXI) 7-Chlor-2,3,4*a*,5-tetrahydro-2-[methoxycarbonyl(4-trifluormethoxyphenyl)-carbamoyl]indol[1,2*e*]oxazolin-4*a*-carboxylat (DPX-MP062, Indoxycarb), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 453;

(CLXXXII) *N*-tert.-butyl-*N'*-(3,5-dimethylbenzoyl)-3-methoxy-2-methylbenzohydrazid (RH-2485, Methoxyfenozone), aus The Pesticide Manual, 11thEd. (1997), The British Crop Protection Council, London, Seite 1094; und
(CLXXXIII) (*N'*-[4-Methoxy-biphenyl-3-yl]-hydrazincarbonsäure-isopropylester (D 2341), aus Brighton Crop Protection Conference, 1996, 487- 493;
(R2) Book of Abstracts, 212th ACS National Meeting Orlando, FL, August 25-29 (1996), AGRO-020. Publisher: American Chemical Society, Washington, D.C. CONEN: 63BFAF.

Den obigen Ausführungen zufolge betrifft ein weiterer wesentlicher Aspekt der vorliegenden Erfindung Kombinationspräparate zur Bekämpfung von Parasiten an Warmblütern, dadurch gekennzeichnet, dass diese neben einer Verbindung der Formel I mindestens einen weiteren Wirkstoff gleicher oder anderer Wirkungsrichtung und mindestens einen physiologisch verträglichen Trägerstoff enthält. Die vorliegende Erfindung beschränkt sich nicht auf Zweierkombinationen.

Die erfindungsgemässen anthelmintischen Mittel enthalten in der Regel 0,1 bis 99 Gew.-%, insbesondere 0,1 bis 95 Gew.-% Wirkstoff der Formel I, Ia oder Gemische davon, 99,9 bis 1 Gew.-%, insbesondere 99,8 bis 5 Gew.-%, eines festen oder flüssigen Zusatzstoffes, darunter 0 bis 25 Gew.-%, insbesondere 0,1 bis 25 Gew.-%, eines Tensides.

Die Applikation der erfindungsgemässen Mittel an die zu behandelnden Tiere kann topisch, peroral, parenteral oder subkutan durchgeführt werden, wobei die Mittel in Form von Lösungen, Emulsionen, Suspensionen (Drenches), Pulvern, Tabletten, Boli, Kapseln und als Pour-on-Formulierungen vorliegen.

Die Pour-on- bzw. Spot-on-Methode besteht darin, dass man die Verbindung der Formel I auf eine lokal begrenzte Haut- oder Fellpartie, vorteilhafterweise am Nacken oder Rückgrat des Tieres aufträgt. Dies geschieht z.B. dadurch, dass man einen Tupfer oder Spritzer der Pour-on- bzw. Spot-on-Formulierung auf eine relativ kleine Fläche des Fells gibt, von wo aus sich die Aktivsubstanz wegen der spreitenden Bestandteile der Formulierung und unterstützt von den Bewegungen des Tieres nahezu selbständig über weite Bereiche des Fells verteilt.

Pour-on- bzw. Spot-on-Formulierungen enthalten zweckmässigerweise Träger, welche die rasche Verteilung auf der Hautoberfläche bzw. im Fell des Wirtstieres fördern und im allgemeinen als spreitende Öle bezeichnet werden. Geeignet sind z.B. ölige Lösungen; alkoholische und isopropanolische Lösungen, wie z.B. Lösungen von 2-Octyldodecanol oder Ole-

ylalkohol; Lösungen in Estern von Monocarbonsäuren, wie Isopropylmyristat, Isopropylpalmitat, Laurinsäureoxalester, Ölsäureoleylester, Ölsäuredecylester, Hexyllaurat, Oleyloleat, Decyloleat, Caprinsäureester von gesättigten Fettalkoholen der Kettenlänge C_{12} - C_{18} ; Lösungen von Estern von Dicarbonsäuren, wie Dibutylphthalat, Diisopropylisophthalat, Adipinsäurediisopropylester, Di-n-butyladipat oder auch Lösungen von Estern aliphatischer Säuren, z.B. Glykolen. Es kann von Vorteil sein, wenn zusätzlich ein aus der pharmazeutischen oder kosmetischen Industrie bekanntes Dispergiermittel anwesend ist. Beispiele sind 2-Pyrrolidon, 2-(N-Alkyl)pyrrolidon, Aceton, Polyethylenglykol und seine Ether und Ester, Propylenglykol oder synthetische Triglyceride.

Die öligen Lösungen umfassen z.B. pflanzliche Öle, wie Olivenöl, Erdnussöl, Sesamöl, Kiefernöl, Leinöl oder Rizinusöl. Die pflanzlichen Öle können auch in epoxidierter Form vorliegen. Man kann auch Paraffine und Silikonöle verwenden.

Im allgemeinen enthält eine Pour-on- bzw. Spot-on-Formulierung 1 bis 20 Gewichts-% einer Verbindung der Formel I, 0,1 bis 50 Gewichts-% Dispergiermittel und 45 bis 98,9 Gewichts-% Lösungsmittel.

Die Pour-on- bzw. Spot-on-Methode lässt sich besonders vorteilhaft bei Herdentieren, wie Rindern, Pferden, Schafen oder Schweinen einsetzen, bei denen es schwierig oder zeitaufwändig ist, sämtliche Tiere oral oder via Injektion zu behandeln. Wegen ihrer Einfachheit kann diese Methode natürlich auch bei allen andern Tieren, auch einzelnen Haus- oder Schosstieren eingesetzt werden und erfreut sich grosser Beliebtheit bei den Tierhaltern, weil sie oft ohne den fachmännischen Beistand des Veterinärs durchgeführt werden kann.

Während als Handelsware eher konzentrierte Mittel bevorzugt werden, verwendet der Endverbraucher in der Regel verdünnte Mittel.

Solche Mittel können noch weitere Zusätze wie Stabilisatoren, Entschäumer, Viskositätsregulatoren, Bindemittel, Haftmittel sowie andere Wirkstoffe zur Erzielung spezieller Effekte enthalten.

Derartige vom Endverbraucher verwendete anthelmintische Mittel sind ebenfalls ein Bestandteil der vorliegenden Erfindung.

In jedem der erfindungsgemässen Verfahren zur Schädlingsbekämpfung bzw. der erfindungsgemässen Schädlingsbekämpfungsmittel können die Wirkstoffe der Formel I in allen ihren räumlichen Konfigurationen oder deren Mischungen eingesetzt werden.

Die Erfindung schliesst auch ein Verfahren zum prophylaktischen Schutz von Warmblütern, insbesondere von Nutz-, Haus- und Schosstieren gegen parasitäre Helminthen ein, das dadurch gekennzeichnet ist, dass man die Wirkstoffe der Formel bzw. die daraus bereiteten Wirkstoffformulierungen als Zusatz zum Futter oder zu den Tränken oder auch in fester oder flüssiger Form oral, durch Injektion oder parenteral den Tieren appliziert. Die Erfindung schliesst auch die erfindungsgemässen Verbindungen der Formel I zur Verwendung in einem der genannten Verfahren ein.

Die nachfolgenden Beispiele dienen lediglich der Illustration der Erfindung, ohne sie einzuschränken, wobei der Begriff Wirkstoff stellvertretend für eine in den Tabellen ... aufgeführte Substanz steht.

Insbesondere setzen sich bevorzugte Formulierungen folgendermassen zusammen:

(% = Gewichtsprozent)

Formulierungsbeispiele

1. Granulat

	a)	b)
Wirkstoff	5 %	10 %
Kaolin	94 %	-
Hochdisperse Kieselsäure	1 %	-
Attapulgit	-	90 %

Der Wirkstoff wird in Methylenchlorid gelöst, auf den Träger aufgesprüht und das Lösungsmittel anschliessend im Vakuum eingedampft. Solche Granulate können dem Viehfutter beigemischt werden.

2. Granulat

Wirkstoff	3 %
Polyethylenglykol (MG 200)	3 %
Kaolin	94 %

(MG = Molekulargewicht)

Der fein gemahlene Wirkstoff wird in einem Mischer auf das mit Polyethylenglykol angefeuchtete Kaolin gleichmässig aufgetragen. Auf diese Weise erhält man staubfreie Umhüllungs-Granulate.

3. Tabletten bzw. Boli

I	Wirkstoff	33,00 %
---	-----------	---------

	Methylcellulose	0,80 %
	Kieselsäure hochdispers	0,80 %
	Maisstärke	8,40 %
II	Milchzucker krist.	22,50 %
	Maisstärke	17,00 %
	mikrokrist. Cellulose	16,50 %
	Magnesiumstearat	1,00 %

- I Methylcellulose wird in Wasser eingerührt. Nachdem das Material gequollen ist, wird Kieselsäure eingerührt und das Gemisch homogen suspendiert. Wirkstoff und Maisstärke werden gemischt. In diese Mischung wird die wässrige Suspension eingearbeitet und zu einem Teig geknetet. Die so erhaltene Masse wird durch ein 12 M-Sieb granuliert und getrocknet.
- II Alle 4 Hilfsstoffe werden gut gemischt.
- III Die gemäss I und II erhaltenen Vormischungen werden gemischt und zu Tabletten oder Boli verpresst.

4. Injektibles

A. Öliges Vehikel (langsame Freisetzung)

- | | | |
|----|-----------|-----------|
| 1. | Wirkstoff | 0,1-1,0 g |
| | Erdnussöl | ad 100 ml |
| 2. | Wirkstoff | 0,1-1,0 g |
| | Sesamöl | ad 100 ml |

Herstellung: Der Wirkstoff wird in einem Teil des Öls unter Rühren und gegebenenfalls leichtem Erwärmen gelöst, nach Abkühlung auf das Sollvolumen aufgefüllt und durch ein geeignetes Membranfilter mit 0,22 mm sterilfiltriert.

B. Wassermischbares Lösungsmittel (mittlere Freisetzungsgeschwindigkeit)

- | | |
|--|-----------|
| Wirkstoff | 0,1-1,0 g |
| 4-Hydroxymethyl-1,3-dioxolan (Glycerol Formal) | 40 g |
| 1,2-Propandiol | ad 100 ml |
| Wirkstoff | 0,1-1,0 g |
| Glycerindimethylketal | 40 g |
| 1,2-Propandiol | ad 100 ml |

Herstellung: Der Wirkstoff wird in einem Teil des Lösungsmittels unter Rühren gelöst, auf das Sollvolumen aufgefüllt und durch ein geeignetes Membranfilter mit 0.22 mm steril-filtriert.

C. Wässriges Solubilisat (rasche Freisetzung)

1. Wirkstoff	0,1-1,0 g
Polyethoxyliertes Rizinusöl (40 Äthylenoxideinheiten)	10 g
1,2-Propandiol	20 g
Benzylalkohol	1 g
Aqua ad injekt.	ad 100 ml
2. Wirkstoff	0,1-1,0 g
Polyethoxyliertes Sorbitanmonooleat (20 Äthylenoxideinheiten)	8 g
4-Hydroxymethyl-1,3-dioxolan (Glycerol Formal)	20 g
Benzylalkohol	1 g
Aqua ad injekt.	ad 100 ml

Herstellung: Der Wirkstoff wird in den Lösungsmitteln und dem Tensid gelöst und mit Wasser auf das Sollvolumen aufgefüllt. Sterilfiltration durch geeignetes Membranfilter mit 0,22 mm Porendurchmesser.

5. Pour-on

A.

Wirkstoff	5 g
Isopropylmyristat	10 g
Isopropanol	ad 100 mL

B.

Wirkstoff	2 g
Hexyllaurat	5 g
mittelkettige Triglyceride	15 g
Ethanol	ad 100 mL

C.

Wirkstoff	2 g
Oleyoleat	5 g
N-Methyl-pyrrolidon	40 g
Isopropanol	ad 100 mL

Die wässrigen Systeme können bevorzugterweise auch für die orale und/oder intraruminale Applikation eingesetzt werden.

Die Mittel können auch weitere Zusätze wie Stabilisatoren, z.B. gegebenenfalls epoxidierte Pflanzenöle (epoxidiertes Kokosnussöl, Rapsöl oder Sojaöl), Entschäumer, z.B. Silikonöl, Konservierungsmittel, Viskositätsregulatoren, Bindemittel, Haftmittel sowie Dünger oder andere Wirkstoffe zur Erzielung spezieller Effekte enthalten.

Es können zudem weitere biologisch aktive Substanzen oder Zusätze, die sich gegenüber den Verbindungen der Formel I neutral verhalten und keinen schädlichen Einfluss auf das zu behandelnde Wirtstier haben, sowie Mineralsalze oder Vitamine den beschriebenen Kompositionen zugesetzt werden.

Die folgenden Beispiele dienen der Erläuterung der Erfindung. Sie schränken die Erfindung nicht ein. Das Symbol 'h' steht für Stunde.

Herstellungsbeispiele

Beispiel 1: N-[1-Cyan-1-methyl-2-(5-chlorbenztriazol-1-yl)-ethyl]-4-trifluormethoxybenzamid

a) In 50 ml Aceton wird eine Mischung aus 5 g 5-Chlorbenztriazol, 1,4 g Chloraceton, 5,1 g Kaliumcarbonat und 0,5 g Kaliumiodid während 48 h bei Raumtemperatur gerührt.

Anschliessend wird filtriert, das Filtrat am Vakuum eingedampft und der Rückstand flash-chromatographisch gereinigt. Man isoliert auf diese Weise die zwei isomeren Produkte 1-(5-Chlorbenztriazol-1-yl)-propan-2-on und 1-(6-Chlorbenztriazol-1-yl)-propan-2-on in etwa gleicher Menge, wovon das erstere im nächsten Schritt direkt weiter verarbeitet wird.

b) Man löst 240 mg 1-(5-Chlorbenztriazol-1-yl)-propan-2-on in 4 ml einer 2-molaren Lösung von Ammoniak in Ethanol, fügt 64 mg Natriumcyanid und 91 mg Ammoniumchlorid zu und rührt das Gemisch über Nacht bei Raumtemperatur. Anschliessend wird das Reaktionsgemisch am Vakuum eingedampft, in Ethylacetat wieder gelöst und mit Wasser und gesättigter Kochsalzlösung gewaschen. Die organische Phase wird abgetrennt, mit Magnesiumsulfat getrocknet und eingedampft. Man erhält so 2-Amino-3-(5-chlorbenztriazol-1-yl)-2-methylpropionitril.

c) In 8 ml trockenem Dichlormethan werden 258 mg 2-Amino-3-(5-chlorbenztriazol-1-yl)-2-methylpropionitril gelöst, mit 194 mg Ethyldiisopropylamin, 16 mg 4-Dimethylaminopyridin und 292 mg 4-(2-Trifluormethoxy)-benzoylchlorid zugefügt und anschliessend bei Raumtemperatur während 7 h gerührt. Danach wird das Reaktionsgemisch mit Ethylacetat

verdünnt, dann mit einer gesättigten Natriumbicarbonat-Lösung und mit gesättigter Kochsalzlösung gewaschen. Nach Trocknung der organischen Phase mit Magnesiumsulfat und Eindampfen wird der Rückstand in Diethylether umkristallisiert. Man erhält so die Titelverbindung mit einem Schmelzpunkt von 135°C.

Analog zu der vorgehend beschriebenen Arbeitsweise lassen sich auch die in der nachfolgenden Tabelle genannten Substanzen herstellen. Die Werte der Schmelzpunkte sind in °C angegeben. Bdg. bedeutet eine direkte Bindung.



Nr.	Y ₁	(R ₁) _m	R ₇₁	phys. Daten
1.1	Bdg.	H	H	
1.2	Bdg.	H	2-Cl	
1.3	Bdg.	H	3-Cl	
1.4	Bdg.	H	4-Cl	
1.5	Bdg.	H	2-F	
1.6	Bdg.	H	3-F	
1.7	Bdg.	H	4-F	
1.8	Bdg.	H	2-CH ₃	
1.9	Bdg.	H	3-CH ₃	
1.10	Bdg.	H	4-CH ₃	
1.11	Bdg.	H	2-OCH ₃	
1.12	Bdg.	H	3-OCH ₃	
1.13	Bdg.	H	4-OCH ₃	
1.14	Bdg.	H	2-CF ₃	
1.15	Bdg.	H	3-CF ₃	
1.16	Bdg.	H	4-CF ₃	
1.17	Bdg.	H	2-OCF ₃	
1.18	Bdg.	H	3-OCF ₃	
1.19	Bdg.	H	4-OCF ₃	
1.20	Bdg.	H	2-OCF ₂ CF ₂	
1.21	Bdg.	H	3-OCF ₂ CF ₂	
1.22	Bdg.	H	4-OCF ₂ CF ₂	
1.23	Bdg.	H	2-OC ₂ F ₅	
1.24	Bdg.	H	3-OC ₂ F ₅	
1.25	Bdg.	H	4-OC ₂ F ₅	
1.26	Bdg.	H	2-OC ₆ H ₅	
1.27	Bdg.	H	3-OC ₆ H ₅	
1.28	Bdg.	H	4-OC ₆ H ₅	
1.29	Bdg.	H	2-C(O)C ₆ H ₅	
1.30	Bdg.	H	3-C(O)C ₆ H ₅	
1.31	Bdg.	H	4-C(O)C ₆ H ₅	
1.32	Bdg.	H	4-CN	
1.33	Bdg.	5-Cl	H	
1.34	Bdg.	5-Cl	2-Cl	
1.35	Bdg.	5-Cl	3-Cl	
1.36	Bdg.	5-Cl	4-Cl	
1.37	Bdg.	5-Cl	2-F	
1.38	Bdg.	5-Cl	3-F	
1.39	Bdg.	5-Cl	4-F	

1.40	Bdg.	5-Cl	2-CH ₃	
1.41	Bdg.	5-Cl	3-CH ₃	
1.42	Bdg.	5-Cl	4-CH ₃	
1.43	Bdg.	5-Cl	2-OCH ₃	
1.44	Bdg.	5-Cl	3-OCH ₃	
1.45	Bdg.	5-Cl	4-OCH ₃	
1.46	Bdg.	5-Cl	2-CF ₃	
1.47	Bdg.	5-Cl	3-CF ₃	
1.48	Bdg.	5-Cl	4-CF ₃	
1.49	Bdg.	5-Cl	2-OCF ₃	
1.50	Bdg.	5-Cl	3-OCF ₃	
1.51	Bdg.	5-Cl	4-OCF ₃	Smp. 135°
1.52	Bdg.	5-Cl	2-OCF ₂ CF ₂	
1.53	Bdg.	5-Cl	3-OCF ₂ CF ₂	
1.54	Bdg.	5-Cl	4-OCF ₂ CF ₂	
1.55	Bdg.	5-Cl	2-OC ₂ F ₅	
1.56	Bdg.	5-Cl	3-OC ₂ F ₅	
1.57	Bdg.	5-Cl	4-OC ₂ F ₅	
1.58	Bdg.	5-Cl	2-OC ₆ H ₅	
1.59	Bdg.	5-Cl	3-OC ₆ H ₅	
1.60	Bdg.	5-Cl	4-OC ₆ H ₅	
1.61	Bdg.	5-Cl	2-C(O)C ₆ H ₅	
1.62	Bdg.	5-Cl	3-C(O)C ₆ H ₅	
1.63	Bdg.	5-Cl	4-C(O)C ₆ H ₅	
1.64	Bdg.	5-Cl	4-CN	
1.65	Bdg.	6-Cl	H	
1.66	Bdg.	6-Cl	2-Cl	
1.67	Bdg.	6-Cl	3-Cl	
1.68	Bdg.	6-Cl	4-Cl	
1.69	Bdg.	6-Cl	2-F	
1.70	Bdg.	6-Cl	3-F	
1.71	Bdg.	6-Cl	4-F	
1.72	Bdg.	6-Cl	2-CH ₃	
1.73	Bdg.	6-Cl	3-CH ₃	
1.74	Bdg.	6-Cl	4-CH ₃	
1.75	Bdg.	6-Cl	2-OCH ₃	
1.76	Bdg.	6-Cl	3-OCH ₃	
1.77	Bdg.	6-Cl	4-OCH ₃	
1.78	Bdg.	6-Cl	2-CF ₃	
1.79	Bdg.	6-Cl	3-CF ₃	
1.80	Bdg.	6-Cl	4-CF ₃	
1.81	Bdg.	6-Cl	2-OCF ₃	
1.82	Bdg.	6-Cl	3-OCF ₃	
1.83	Bdg.	6-Cl	4-OCF ₃	Smp. 124°
1.84	Bdg.	6-Cl	2-OCF ₂ CF ₂	
1.85	Bdg.	6-Cl	3-OCF ₂ CF ₂	
1.86	Bdg.	6-Cl	4-OCF ₂ CF ₂	
1.87	Bdg.	6-Cl	2-OC ₂ F ₅	
1.88	Bdg.	6-Cl	3-OC ₂ F ₅	
1.89	Bdg.	6-Cl	4-OC ₂ F ₅	

1.90	Bdg.	6-Cl	2-OC ₆ H ₅
1.91	Bdg.	6-Cl	3-OC ₆ H ₅
1.92	Bdg.	6-Cl	4-OC ₆ H ₅
1.93	Bdg.	6-Cl	2-C(O)C ₆ H ₅
1.94	Bdg.	6-Cl	3-C(O)C ₆ H ₅
1.95	Bdg.	6-Cl	4-C(O)C ₆ H ₅
1.96	Bdg.	6-Cl	4-CN
1.97	Bdg.	5-Cl, 6-F	H
1.98	Bdg.	5-Cl, 6-F	2-Cl
1.99	Bdg.	5-Cl, 6-F	3-Cl
1.100	Bdg.	5-Cl, 6-F	4-Cl
1.101	Bdg.	5-Cl, 6-F	2-F
1.102	Bdg.	5-Cl, 6-F	3-F
1.103	Bdg.	5-Cl, 6-F	4-F
1.104	Bdg.	5-Cl, 6-F	2-CH ₃
1.105	Bdg.	5-Cl, 6-F	3-CH ₃
1.106	Bdg.	5-Cl, 6-F	4-CH ₃
1.107	Bdg.	5-Cl, 6-F	2-OCH ₃
1.108	Bdg.	5-Cl, 6-F	3-OCH ₃
1.109	Bdg.	5-Cl, 6-F	4-OCH ₃
1.110	Bdg.	5-Cl, 6-F	2-CF ₃
1.111	Bdg.	5-Cl, 6-F	3-CF ₃
1.112	Bdg.	5-Cl, 6-F	4-CF ₃
1.113	Bdg.	5-Cl, 6-F	2-OCF ₃
1.114	Bdg.	5-Cl, 6-F	3-OCF ₃
1.115	Bdg.	5-Cl, 6-F	4-OCF ₃
1.116	Bdg.	5-Cl, 6-F	2-OCF ₂ CF ₂
1.117	Bdg.	5-Cl, 6-F	3-OCF ₂ CF ₂
1.118	Bdg.	5-Cl, 6-F	4-OCF ₂ CF ₂
1.119	Bdg.	5-Cl, 6-F	2-OC ₂ F ₅
1.120	Bdg.	5-Cl, 6-F	3-OC ₂ F ₅
1.121	Bdg.	5-Cl, 6-F	4-OC ₂ F ₅
1.122	Bdg.	5-Cl, 6-F	2-OC ₆ H ₅
1.123	Bdg.	5-Cl, 6-F	3-OC ₆ H ₅
1.124	Bdg.	5-Cl, 6-F	4-OC ₆ H ₅
1.125	Bdg.	5-Cl, 6-F	2-C(O)C ₆ H ₅
1.126	Bdg.	5-Cl, 6-F	3-C(O)C ₆ H ₅
1.127	Bdg.	5-Cl, 6-F	4-C(O)C ₆ H ₅
1.128	Bdg.	5-Cl, 6-F	4-CN
1.129	Bdg.	6-Cl, 5-F	H
1.130	Bdg.	6-Cl, 5-F	2-Cl
1.131	Bdg.	6-Cl, 5-F	3-Cl
1.132	Bdg.	6-Cl, 5-F	4-Cl
1.133	Bdg.	6-Cl, 5-F	2-F
1.134	Bdg.	6-Cl, 5-F	3-F
1.135	Bdg.	6-Cl, 5-F	4-F
1.136	Bdg.	6-Cl, 5-F	2-CH ₃
1.137	Bdg.	6-Cl, 5-F	3-CH ₃
1.138	Bdg.	6-Cl, 5-F	4-CH ₃
1.139	Bdg.	6-Cl, 5-F	2-OCH ₃

fest

1.140	Bdg.	6-Cl, 5-F	3-OCH ₃	
1.141	Bdg.	6-Cl, 5-F	4-OCH ₃	
1.142	Bdg.	6-Cl, 5-F	2-CF ₃	
1.143	Bdg.	6-Cl, 5-F	3-CF ₃	
1.144	Bdg.	6-Cl, 5-F	4-CF ₃	
1.145	Bdg.	6-Cl, 5-F	2-OCF ₃	
1.146	Bdg.	6-Cl, 5-F	3-OCF ₃	
1.147	Bdg.	6-Cl, 5-F	4-OCF ₃	fest
1.148	Bdg.	6-Cl, 5-F	2-OCF ₂ CF ₂	
1.149	Bdg.	6-Cl, 5-F	3-OCF ₂ CF ₂	
1.150	Bdg.	6-Cl, 5-F	4-OCF ₂ CF ₂	
1.151	Bdg.	6-Cl, 5-F	2-OC ₂ F ₅	
1.152	Bdg.	6-Cl, 5-F	3-OC ₂ F ₅	
1.153	Bdg.	6-Cl, 5-F	4-OC ₂ F ₅	
1.154	Bdg.	6-Cl, 5-F	2-OC ₆ H ₅	
1.155	Bdg.	6-Cl, 5-F	3-OC ₆ H ₅	
1.156	Bdg.	6-Cl, 5-F	4-OC ₆ H ₅	
1.157	Bdg.	6-Cl, 5-F	2-C(O)C ₆ H ₅	
1.158	Bdg.	6-Cl, 5-F	3-C(O)C ₆ H ₅	
1.159	Bdg.	6-Cl, 5-F	4-C(O)C ₆ H ₅	
1.160	Bdg.	6-Cl, 5-F	4-CN	
1.161	CH ₂ O	H	H	
1.162	CH ₂ O	H	2-Cl	
1.163	CH ₂ O	H	3-Cl	
1.164	CH ₂ O	H	4-Cl	
1.165	CH ₂ O	H	2-F	
1.166	CH ₂ O	H	3-F	
1.167	CH ₂ O	H	4-F	
1.168	CH ₂ O	H	2-CH ₃	
1.169	CH ₂ O	H	3-CH ₃	
1.170	CH ₂ O	H	4-CH ₃	
1.171	CH ₂ O	H	2-OCH ₃	
1.172	CH ₂ O	H	3-OCH ₃	
1.173	CH ₂ O	H	4-OCH ₃	
1.174	CH ₂ O	H	2-CF ₃	
1.175	CH ₂ O	H	3-CF ₃	
1.176	CH ₂ O	H	4-CF ₃	
1.177	CH ₂ O	H	2-OCF ₃	
1.178	CH ₂ O	H	3-OCF ₃	
1.179	CH ₂ O	H	4-OCF ₃	
1.180	CH ₂ O	H	2-OCF ₂ CF ₂	
1.181	CH ₂ O	H	3-OCF ₂ CF ₂	
1.182	CH ₂ O	H	4-OCF ₂ CF ₂	
1.183	CH ₂ O	H	2-OC ₂ F ₅	
1.184	CH ₂ O	H	3-OC ₂ F ₅	
1.185	CH ₂ O	H	4-OC ₂ F ₅	
1.186	CH ₂ O	H	2-OC ₆ H ₅	
1.187	CH ₂ O	H	3-OC ₆ H ₅	
1.188	CH ₂ O	H	4-OC ₆ H ₅	
1.189	CH ₂ O	H	2-C(O)C ₆ H ₅	

1.190	CH ₂ O	H	3-C(O)C ₆ H ₅
1.191	CH ₂ O	H	4-C(O)C ₆ H ₅
1.192	CH ₂ O	H	4-CN
1.193	CH ₂ O	5-Cl	H
1.194	CH ₂ O	5-Cl	2-Cl
1.195	CH ₂ O	5-Cl	3-Cl
1.196	CH ₂ O	5-Cl	4-Cl
1.197	CH ₂ O	5-Cl	2-F
1.198	CH ₂ O	5-Cl	3-F
1.199	CH ₂ O	5-Cl	4-F
1.200	CH ₂ O	5-Cl	2-CH ₃
1.201	CH ₂ O	5-Cl	3-CH ₃
1.202	CH ₂ O	5-Cl	4-CH ₃
1.203	CH ₂ O	5-Cl	2-OCH ₃
1.204	CH ₂ O	5-Cl	3-OCH ₃
1.205	CH ₂ O	5-Cl	4-OCH ₃
1.206	CH ₂ O	5-Cl	2-CF ₃
1.207	CH ₂ O	5-Cl	3-CF ₃
1.208	CH ₂ O	5-Cl	4-CF ₃
1.209	CH ₂ O	5-Cl	2-OCF ₃
1.210	CH ₂ O	5-Cl	3-OCF ₃
1.211	CH ₂ O	5-Cl	4-OCF ₃
1.212	CH ₂ O	5-Cl	2-OCF ₂ CF ₂
1.213	CH ₂ O	5-Cl	3-OCF ₂ CF ₂
1.214	CH ₂ O	5-Cl	4-OCF ₂ CF ₂
1.215	CH ₂ O	5-Cl	2-OC ₂ F ₅
1.216	CH ₂ O	5-Cl	3-OC ₂ F ₅
1.217	CH ₂ O	5-Cl	4-OC ₂ F ₅
1.218	CH ₂ O	5-Cl	2-OC ₆ H ₅
1.219	CH ₂ O	5-Cl	3-OC ₆ H ₅
1.220	CH ₂ O	5-Cl	4-OC ₆ H ₅
1.221	CH ₂ O	5-Cl	2-C(O)C ₆ H ₅
1.222	CH ₂ O	5-Cl	3-C(O)C ₆ H ₅
1.223	CH ₂ O	5-Cl	4-C(O)C ₆ H ₅
1.224	CH ₂ O	5-Cl	4-CN
1.225	CH ₂ O	6-Cl	H
1.226	CH ₂ O	6-Cl	2-Cl
1.227	CH ₂ O	6-Cl	3-Cl
1.228	CH ₂ O	6-Cl	4-Cl
1.229	CH ₂ O	6-Cl	2-F
1.230	CH ₂ O	6-Cl	3-F
1.231	CH ₂ O	6-Cl	4-F
1.232	CH ₂ O	6-Cl	2-CH ₃
1.233	CH ₂ O	6-Cl	3-CH ₃
1.234	CH ₂ O	6-Cl	4-CH ₃
1.235	CH ₂ O	6-Cl	2-OCH ₃
1.236	CH ₂ O	6-Cl	3-OCH ₃
1.237	CH ₂ O	6-Cl	4-OCH ₃
1.238	CH ₂ O	6-Cl	2-CF ₃
1.239	CH ₂ O	6-Cl	3-CF ₃

194202

- 41 -

1.240	CH ₂ O	6-Cl	4-CF ₃
1.241	CH ₂ O	6-Cl	2-OCF ₃
1.242	CH ₂ O	6-Cl	3-OCF ₃
1.243	CH ₂ O	6-Cl	4-OCF ₃
1.244	CH ₂ O	6-Cl	2-OCF ₂ CF ₂
1.245	CH ₂ O	6-Cl	3-OCF ₂ CF ₂
1.246	CH ₂ O	6-Cl	4-OCF ₂ CF ₂
1.247	CH ₂ O	6-Cl	2-OC ₂ F ₅
1.248	CH ₂ O	6-Cl	3-OC ₂ F ₅
1.249	CH ₂ O	6-Cl	4-OC ₂ F ₅
1.250	CH ₂ O	6-Cl	2-OC ₆ H ₅
1.251	CH ₂ O	6-Cl	3-OC ₆ H ₅
1.252	CH ₂ O	6-Cl	4-OC ₆ H ₅
1.253	CH ₂ O	6-Cl	2-C(O)C ₆ H ₅
1.254	CH ₂ O	6-Cl	3-C(O)C ₆ H ₅
1.255	CH ₂ O	6-Cl	4-C(O)C ₆ H ₅
1.256	CH ₂ O	6-Cl	4-CN
1.257	CH ₂ O	5-Cl, 6-F	H
1.258	CH ₂ O	5-Cl, 6-F	2-Cl
1.259	CH ₂ O	5-Cl, 6-F	3-Cl
1.260	CH ₂ O	5-Cl, 6-F	4-Cl
1.261	CH ₂ O	5-Cl, 6-F	2-F
1.262	CH ₂ O	5-Cl, 6-F	3-F
1.263	CH ₂ O	5-Cl, 6-F	4-F
1.264	CH ₂ O	5-Cl, 6-F	2-CH ₃
1.265	CH ₂ O	5-Cl, 6-F	3-CH ₃
1.266	CH ₂ O	5-Cl, 6-F	4-CH ₃
1.267	CH ₂ O	5-Cl, 6-F	2-OCH ₃
1.268	CH ₂ O	5-Cl, 6-F	3-OCH ₃
1.269	CH ₂ O	5-Cl, 6-F	4-OCH ₃
1.270	CH ₂ O	5-Cl, 6-F	2-CF ₃
1.271	CH ₂ O	5-Cl, 6-F	3-CF ₃
1.272	CH ₂ O	5-Cl, 6-F	4-CF ₃
1.273	CH ₂ O	5-Cl, 6-F	2-OCF ₃
1.274	CH ₂ O	5-Cl, 6-F	3-OCF ₃
1.275	CH ₂ O	5-Cl, 6-F	4-OCF ₃
1.276	CH ₂ O	5-Cl, 6-F	2-OCF ₂ CF ₂
1.277	CH ₂ O	5-Cl, 6-F	3-OCF ₂ CF ₂
1.278	CH ₂ O	5-Cl, 6-F	4-OCF ₂ CF ₂
1.279	CH ₂ O	5-Cl, 6-F	2-OC ₂ F ₅
1.280	CH ₂ O	5-Cl, 6-F	3-OC ₂ F ₅
1.281	CH ₂ O	5-Cl, 6-F	4-OC ₂ F ₅
1.282	CH ₂ O	5-Cl, 6-F	2-OC ₆ H ₅
1.283	CH ₂ O	5-Cl, 6-F	3-OC ₆ H ₅
1.284	CH ₂ O	5-Cl, 6-F	4-OC ₆ H ₅
1.285	CH ₂ O	5-Cl, 6-F	2-C(O)C ₆ H ₅
1.286	CH ₂ O	5-Cl, 6-F	3-C(O)C ₆ H ₅
1.287	CH ₂ O	5-Cl, 6-F	4-C(O)C ₆ H ₅
1.288	CH ₂ O	5-Cl, 6-F	4-CN
1.289	CH ₂ O	6-Cl, 5-F	H

154200

1.290	CH ₂ O	6-Cl, 5-F	2-Cl
1.291	CH ₂ O	6-Cl, 5-F	3-Cl
1.292	CH ₂ O	6-Cl, 5-F	4-Cl
1.293	CH ₂ O	6-Cl, 5-F	2-F
1.294	CH ₂ O	6-Cl, 5-F	3-F
1.295	CH ₂ O	6-Cl, 5-F	4-F
1.296	CH ₂ O	6-Cl, 5-F	2-CH ₃
1.297	CH ₂ O	6-Cl, 5-F	3-CH ₃
1.298	CH ₂ O	6-Cl, 5-F	4-CH ₃
1.299	CH ₂ O	6-Cl, 5-F	2-OCH ₃
1.300	CH ₂ O	6-Cl, 5-F	3-OCH ₃
1.301	CH ₂ O	6-Cl, 5-F	4-OCH ₃
1.302	CH ₂ O	6-Cl, 5-F	2-CF ₃
1.303	CH ₂ O	6-Cl, 5-F	3-CF ₃
1.304	CH ₂ O	6-Cl, 5-F	4-CF ₃
1.305	CH ₂ O	6-Cl, 5-F	2-OCF ₃
1.306	CH ₂ O	6-Cl, 5-F	3-OCF ₃
1.307	CH ₂ O	6-Cl, 5-F	4-OCF ₃
1.308	CH ₂ O	6-Cl, 5-F	2-OCF ₂ CF ₂
1.309	CH ₂ O	6-Cl, 5-F	3-OCF ₂ CF ₂
1.310	CH ₂ O	6-Cl, 5-F	4-OCF ₂ CF ₂
1.311	CH ₂ O	6-Cl, 5-F	2-OC ₂ F ₅
1.312	CH ₂ O	6-Cl, 5-F	3-OC ₂ F ₅
1.313	CH ₂ O	6-Cl, 5-F	4-OC ₂ F ₅
1.314	CH ₂ O	6-Cl, 5-F	2-OC ₆ H ₅
1.315	CH ₂ O	6-Cl, 5-F	3-OC ₆ H ₅
1.316	CH ₂ O	6-Cl, 5-F	4-OC ₆ H ₅
1.317	CH ₂ O	6-Cl, 5-F	2-C(O)C ₆ H ₅
1.318	CH ₂ O	6-Cl, 5-F	3-C(O)C ₆ H ₅
1.319	CH ₂ O	6-Cl, 5-F	4-C(O)C ₆ H ₅
1.320	CH ₂ O	6-Cl, 5-F	4-CN

Biologische Beispiele

1. In-Vivo-Test gegen Trichostrongylus colubriformis und Haemonchus contortus in Wüsten-Rennmäusen (Meriones unguiculatus) bei peroraler Applikation

Sechs bis acht Wochen alte Wüsten-Rennmäuse werden durch künstliche Ernährung mit je ca. 2000 Larven des 3. Stadiums von *T. colubriformis* und *H. contortus* infiziert. 6 Tage nach der Infektion werden die Rennmäuse mit N_2O leicht anästhesiert und durch perorale Applikation mit den Testverbindungen, gelöst in einer Mischung aus 2 Teilen DMSO und 1 Teil Polyethylenglykol (PEG 300), mit Mengen von 100, 32 und 10 – 0.1 mg/kg behandelt. An Tag 9 (3 Tage nach Behandlung), wenn die meisten der noch vorhandenen *H. contortus* Larven des späten 4. Stadiums und die meisten der *T. colubriformis* unreife Adulte sind, werden die Rennmäuse zum Zählen der Würmer getötet. Die Wirksamkeit wird in % Reduktion der Wurm-Anzahl in jeder Rennmaus durch Vergleich mit dem geometrischen Mittel der Wurm-Anzahl von 8 infizierten und unbehandelten Rennmäusen berechnet.

In diesem Test wird mit Verbindungen der Formel I, insbesondere aus der Tabelle 1, eine starke Reduzierung des Nematodenbefalls erzielt.

Zur Untersuchung der insektiziden und/oder akariziden Wirkung der Verbindungen der Formel I auf Tieren und Pflanzen können die nachfolgenden Versuchs-Methoden angewendet werden.

2. Wirkung gegen L_1 -Larven von Lucilia sericata

1 ml einer wässrigen Suspension der zu prüfenden Aktivsubstanz werden so mit 3 ml eines speziellen Larvenzuchtmediums bei ca. 50°C vermischt, dass ein Homogenisat von wahlweise 250 oder 125 ppm Wirkstoffgehalt entsteht. In jede Reagensglas-Probe werden ca. 30 *Lucilia*-Larven (L_1) eingesetzt. Nach 4 Tagen wird die Mortalitätsrate bestimmt.

3. Akarizide Wirkung gegen Boophilus microplus (Biarra-Stamm)

Auf einer PVC-Platte wird waagerecht ein Klebstreifen so befestigt, dass darauf 10 mit Blut vollgesogene Zecken-Weibchen von *Boophilus microplus* (Biarra-Stamm) nebeneinander in einer Reihe mit dem Rücken aufgeklebt werden können. Jeder Zecke wird mit einer Injektionsnadel 1 µl einer Flüssigkeit injiziert, die eine 1:1-Mischung von Polyethylenglykol und Aceton darstellt und in der eine bestimmte Wirkstoffmenge von wahlweise 1, 0.1 oder 0.01 µg pro Zecke gelöst ist. Kontrolltiere erhalten eine wirkstofffreie Injektion. Nach der Behandlung werden die Tiere unter Normalbedingungen in einem Insektarium bei ca. 28°C und

80% relativer Luftfeuchtigkeit gehalten, bis die Eiablage erfolgt und die Larven aus den Eiern der Kontrolltiere geschlüpft sind. Die Aktivität einer geprüften Substanz wird mit der IR_{90} bestimmt, d. h. es wird jene Wirkstoffdosis ermittelt, bei der noch nach 30 Tagen 9 von 10 Zeckenweibchen (=90%) Eier ablegen, die nicht schlupffähig sind.

4. In-Vitro-Wirksamkeit gegen gefütterte Weibchen von Boophilus microplus (BIARRA):

Es werden 4x10 gefütterte Zeckenweibchen des OP-resistenten BIARRA-Stamms auf ein Klebband geklebt und während 1 h mit einem Wattebausch, welcher mit einer Emulsion oder Suspension der Testverbindung in Konzentrationen von jeweils 500, 125, 31 und 8 ppm getränkt ist, bedeckt. Die Auswertung erfolgt 28 Tage später auf Mortalität Eiablage und Larvenschlüpfen.

Als Indikation der Aktivität der Testverbindungen dient die Zahl der Weibchen, welche

- rasch sterben, bevor sie Eier legen,
- einige Zeit überleben, ohne Eier zu legen,
- Eier legen, in welchen sich keine Embryos bilden,
- Eier legen, in welchen sich Embryos bilden, aus welchen keine Larven schlüpfen, und
- Eier legen, in welchen sich Embryos bilden, aus welchen normalerweise innert 26 bis 27 Tagen Larven schlüpfen.

5. In-Vitro-Wirksamkeit gegen Nymphen von Amblyomma hebraeum

Etwa 5 hungernde Nymphen werden in ein Polystyrol-Teströhrchen gegeben, welches 2 ml der Testverbindung in Lösung, Suspension oder Emulsion enthält.

Nach 10minütigem Eintauchen und 2x10 Sekunden Schütteln auf einem Wirbelmischer werden die Teströhrchen mit einem dichtem Baumwoll-Wattebausch verstopft und umgedreht. Sobald alle Flüssigkeit vom Wattebausch aufgesaugt ist, wird er halbwegs in das noch immer umgedrehte Teströhrchen hineingestossen, so dass die meiste Flüssigkeit aus dem Wattebausch ausgepresst wird und in eine darunter liegende Petrischale fließt.

Die Teströhrchen werden nun bei Raumtemperatur in einem Raum mit Tageslicht bis zur Auswertung aufbewahrt. Nach 14 Tagen werden die Teströhrchen in einen Becher kochenden Wassers eingetaucht. Wenn sich in Reaktion auf die Hitze die Zecken zu bewegen beginnen, ist die Testsubstanz bei der geprüften Konzentration inaktiv, andernfalls werden die Zecken als tot und die Testsubstanz bei der geprüften Konzentration als aktiv betrachtet. Alle Substanzen werden in einem Konzentrationsbereich von 0.1 bis 100 ppm getestet.

6. Wirkung gegen Dermanyssus gallinae

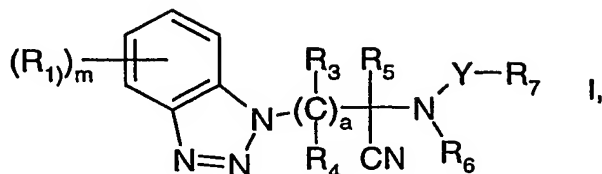
In einem nach oben offenen Glasbehälter werden 2 bis 3 ml einer 10 ppm Wirkstoff enthaltenden Lösung und ca. 200 Milben (*Dermanyssus gallinae*) in unterschiedlichen Entwicklungsstadien gegeben. Anschliessend wird der Behälter mit einem Wattebausch verschlossen, 10 Minuten lang bis zur vollständigen Benetzung der Milben geschüttelt und dann kurzfristig umgekehrt, damit die restliche Testlösung von der Watte aufgenommen werden kann. Nach 3 Tagen wird die Mortalität der Milben durch Auszählen der toten Individuen ermittelt und in Prozent angegeben.

7. Wirkung gegen Musca domestica

Ein Zuckerwürfel wird mit einer Lösung der Testsubstanz so behandelt, dass die Konzentration von Testsubstanz, nach Trocknen über Nacht, im Zucker 250 ppm beträgt. Dieser behandelte Würfel wird mit einem nassen Wattebausch und 10 Adulten *Musca domestica* eines OP resistenten Stammes auf eine Aluminiumschale gelegt, mit einem Becherglas abgedeckt und bei 25° C inkubiert. Nach 24 Stunden wird die Mortalitätsrate bestimmt.

Patentansprüche

1. Verbindungen der Formel



worin

R_1 Halogen, Cyano, Nitro, C_1 - C_6 -Alkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, Halo- C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -Alkylthio, Arylthio, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_3 - C_6 -Cycloalkyloxy, Halo- C_1 - C_6 -alkoxy, C_1 - C_6 -Alkylcarbonyl, Halo- C_1 - C_6 -alkylcarbonyl, C_1 - C_6 -Alkylsulfinyl, C_1 - C_6 -Alkylsulfonyl, C_1 - C_6 -Alkylamino, Di(C_1 - C_6 -alkyl)amino, unsubstituiertes oder substituiertes Aryl oder unsubstituiertes oder substituiertes Phenoxy, wobei die Substituenten jeweils voneinander unabhängig sein können und ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Halogen, Nitro, Cyano, C_1 - C_6 -Alkyl, Halo- C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, Halo- C_1 - C_6 -alkoxy, C_1 - C_6 -Alkylthio, Halo- C_1 - C_6 -alkylthio, C_1 - C_6 -Alkylsulfinyl, Halo- C_1 - C_6 -alkylsulfinyl, C_1 - C_6 -Alkylsulfonyl und Halo- C_1 - C_6 -alkylsulfonyl;

R_3 , R_4 und R_5 entweder unabhängig von einander Wasserstoff, Halogen, C_1 - C_6 -Alkyl, Halo- C_1 - C_6 -alkyl, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes C_3 - C_6 -Cycloalkyl, wobei die Substituenten voneinander unabhängig sein können und ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Halogen und C_1 - C_6 -Alkyl; unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Phenyl, wobei die Substituenten von einander unabhängig sein können und ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Halogen, Nitro, Cyano, C_1 - C_6 -Alkyl, Halo- C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, Halo- C_1 - C_6 -alkoxy, C_1 - C_6 -Alkylthio, Halo- C_1 - C_6 -alkylthio, C_1 - C_6 -Alkylsulfinyl, Halo- C_1 - C_6 -alkylsulfinyl, C_1 - C_6 -Alkylsulfonyl, Halo- C_1 - C_6 -alkylsulfonyl, C_1 - C_6 -Alkylamino oder Di(C_1 - C_6 -alkyl)amino;

oder R_4 und R_5 gemeinsam C_2 - C_6 -Alkylen;

R_6 Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Alkylcarbonyl, C_1 - C_6 -Alkoxy- C_1 - C_6 -alkyl, Aminocarbonyl, C_1 - C_6 -Alkoxy- C_1 - C_6 -alkyl, Thio- C_1 - C_6 -alkylcarbonyl oder Benzyl;

R_7 Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Alkylamino, Di(C_1 - C_6 -alkyl)amino, Piperonyl, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Phenyl, wobei die Substituenten voneinander unabhängig sein können und ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Halogen, Nitro, Cyano, C_1 - C_6 -Alkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, Halo- C_1 - C_6 -alkyl, C_1 -

C_6 -Alkoxy, C_3 - C_6 -Cycloalkyloxy, Halo- C_1 - C_6 -alkoxy, C_2 - C_6 -Alkenyl, Halo- C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -Alkynyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_2 - C_6 -Alkenyloxy, Halo- C_2 - C_6 -alkenyloxy, C_1 - C_6 -Alkylthio, Halo- C_1 - C_6 -alkylthio, C_1 - C_6 -Alkylsulfonyloxy, Halo- C_1 - C_6 -alkylsulfonyloxy, C_1 - C_6 -Alkylsulfinyl, Halo- C_1 - C_6 -alkylsulfinyl, C_1 - C_6 -Alkylsulfonyl, Halo- C_1 - C_6 -alkylsulfonyl, C_2 - C_6 -Alkenylthio, Halo- C_2 - C_6 -alkenylthio, C_2 - C_6 -Alkenylsulfinyl, Halo- C_2 - C_6 -alkenylsulfinyl, C_2 - C_6 -Alkenylsulfonyl, Halo- C_2 - C_6 -alkenylsulfonyl, C_1 - C_6 -Alkylamino, Di(C_1 - C_6 -alkyl)amino, C_1 - C_6 -Alkylsulfonylamino, Halo- C_1 - C_6 -alkylsulfonylamino, C_1 - C_6 -Alkylcarbonyl, Halo- C_1 - C_6 -alkylcarbonyl, C_1 - C_6 -Alkoxy carbonyl, C_1 - C_6 -Alkylaminocarbonyl, Di(C_1 - C_6 -alkyl)aminocarbonyl, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Aryl- C_1 - C_6 -alkyl, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Arylamino, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Arylcarbonyl, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Arylcarbonyloxy, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Aryloxy, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Aryloxy- C_1 - C_6 -alkyl, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Hetarylloxy- C_1 - C_6 -alkyl, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Aryloxy carbonyl, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Arylsulfonyl, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Arylsulfonylamino, unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Pyridyloxy und unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Phenylacetylenyl, wobei jeweils die Substituenten voneinander unabhängig sein können und ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Halogen, Nitro, Cyano, C_1 - C_6 -Alkyl, Halo- C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, Halo- C_1 - C_6 -alkoxy, C_1 - C_6 -Alkylthio, Halo- C_1 - C_6 -alkylthio, C_1 - C_6 -Alkylsulfinyl, Halo- C_1 - C_6 -alkylsulfinyl, C_1 - C_6 -Alkylsulfonyl und Halo- C_1 - C_6 -alkylsulfonyl; unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Hetaryl, wobei die Substituenten voneinander unabhängig sein können und ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Halogen, Nitro, Cyano, C_1 - C_6 -Alkyl, Halo- C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, Halo- C_1 - C_6 -alkoxy, C_2 - C_6 -Alkenyloxy, Halo- C_2 - C_6 -alkenyloxy, C_1 - C_6 -Alkylthio, Halo- C_1 - C_6 -alkylthio, C_1 - C_6 -Alkylsulfinyl, Halo- C_1 - C_6 -alkylsulfinyl, C_2 - C_6 -Alkenylthio, Halo- C_2 - C_6 -alkenylthio, C_2 - C_6 -Alkenylsulfinyl, Halo- C_2 - C_6 -alkenylsulfinyl, C_1 - C_6 -Alkylsulfonyl, Halo- C_1 - C_6 -alkylsulfonyl, C_2 - C_6 -Alkenylsulfonyl, Halo- C_2 - C_6 -alkenylsulfonyl, C_1 - C_6 -Alkylamino und Di(C_1 - C_6 -alkyl)amino; oder unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach substituiertes Naphthyl oder Chinolyl, wobei die Substituenten voneinander unabhängig sein können und ausgewählt sind aus der Gruppe, bestehend aus Halogen, Nitro, Cyano, C_1 - C_6 -Alkyl, Halo- C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, Halo- C_1 - C_6 -alkoxy, C_2 - C_6 -Alkenyloxy, Halo- C_2 - C_6 -alkenyloxy, C_1 - C_6 -Alkylthio, Halo- C_1 - C_6 -

alkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, Halo-C₁-C₆-alkylsulfinyl, C₂-C₆-Alkenylthio, Halo-C₂-C₆-alkenylthio, C₂-C₆-Alkenylsulfinyl, Halo-C₂-C₆-alkenylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, Halo-C₁-C₆-alkylsulfonyl, C₂-C₆-Alkenylsulfonyl, Halo-C₂-C₆-alkenylsulfonyl, C₁-C₆-Alkylamino und Di(C₁-C₆-alkyl)amino;

R₈ und R₉ unabhängig von einander Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkylthiocarbonyl, Thio-C₁-C₆-alkylcarbonyl, Aryl oder Hetaryl;

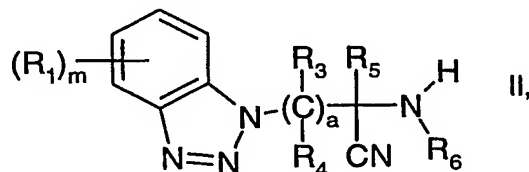
Y eine direkte Bindung, C(O), C(S) oder S(O)_n;

a 1, 2 oder 3;

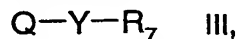
m 0, 1, 2, 3 oder 4; und

n 1 oder 2 ist.

2. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I, jeweils in freier Form oder in Salzform, gemäss Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man eine Verbindung der Formel

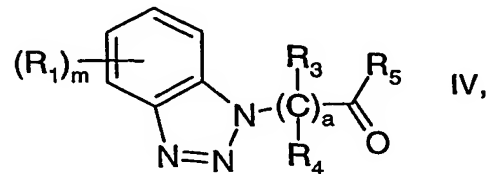


die bekannt ist oder in Analogie zu entsprechenden bekannten Verbindungen hergestellt werden kann und worin R₁, R₃, R₄, R₅, R₆, a und m die für die Formel I angegebenen Bedeutungen haben, mit einer Verbindung der Formel



die bekannt ist oder in Analogie zu entsprechenden bekannten Verbindungen hergestellt werden kann und worin Y und R₇ die für die Formel I angegebenen Bedeutungen hat und Q eine Abgangsgruppe ist, gegebenenfalls in Gegenwart eines basischen Katalysators, umgesetzt, und jeweils, wenn erwünscht, eine verfahrensgemäss oder auf andere Weise erhältliche Verbindung der Formel I, jeweils in freier Form oder in Salzform, in eine andere Verbindung der Formel I überführt, ein verfahrensgemäss erhältliches Gemisch von Isomeren auftrennt und das gewünschte Isomere isoliert und/oder eine verfahrensgemäss erhältliche freie Verbindung der Formel I in ein Salz oder ein verfahrensgemäss erhältliches Salz einer Verbindung der Formel I in die freie Verbindung der Formel I oder in ein anderes Salz überführt.

3. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel II, jeweils in freier Form oder in Salzform, gemäss Anspruch 2, dadurch gekennzeichnet, dass man eine Verbindung der Formel



die bekannt ist oder in Analogie zu entsprechenden bekannten Verbindungen hergestellt werden kann und worin R_1 , R_3 , R_4 , R_5 , a und m die für die Formel I angegebenen Bedeutungen haben, mit einem anorganischen oder organischen Cyanid und einer Verbindung der Formel R_6-NH_2 , die bekannt ist oder in Analogie zu entsprechenden bekannten Verbindungen hergestellt werden kann und worin R_6 die für die Formel I angegebenen Bedeutungen hat, umsetzt, und jeweils, wenn erwünscht, eine verfahrensgemäss oder auf andere Weise erhältliche Verbindung der Formel II, jeweils in freier Form oder in Salzform, in eine andere Verbindung der Formel II überführt, ein verfahrensgemäss erhältliches Gemisch von Isomeren auftrennt und das gewünschte Isomere isoliert und/oder eine verfahrensgemäss erhältliche freie Verbindung der Formel II in ein Salz oder ein verfahrensgemäss erhältliches Salz einer Verbindung der Formel II in die freie Verbindung der Formel II oder in ein anderes Salz überführt.

4. Verwendung von Verbindungen der Formel I gemäss Anspruch 1 zur Bekämpfung von Parasiten.

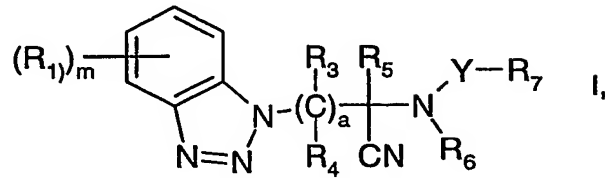
5. Verfahren zur Bekämpfung von Parasiten, dadurch gekennzeichnet, dass eine wirksame Menge mindestens einer Verbindung der Formel I gemäss Anspruch 1 gegen die Parasiten eingesetzt wird.

6. Verwendung einer Verbindung der Formel I gemäss Anspruch 1 in einem Verfahren zur Bekämpfung von Parasiten in Warmblütern.

7. Verwendung einer Verbindung der Formel I gemäss Anspruch 1 zur Herstellung eines pharmazeutischen Mittels gegen Parasiten in Warmblütern.

Zusammenfassung

Die Erfindung betrifft Verbindungen der allgemeinen Formel



worin R_1 , R_3 , R_4 , R_5 , R_6 , R_7 , Y , a und m die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben, und gegebenenfalls Enantiomere davon. Die Wirkstoffe besitzen vorteilhafte pestizide Eigenschaften. Sie eignen sich insbesondere zur Bekämpfung von Parasiten in Warmblütern.

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning
Operations and is not part of the Official Record**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ BLACK BORDERS
- ☐ IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- ☐ FADED TEXT OR DRAWING
- ☐ BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING
- ☐ SKEWED/SLANTED IMAGES
- ☒ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS
- ☐ GRAY SCALE DOCUMENTS
- ☒ LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT
- ☐ REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY
- ☐ OTHER: _____

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.